



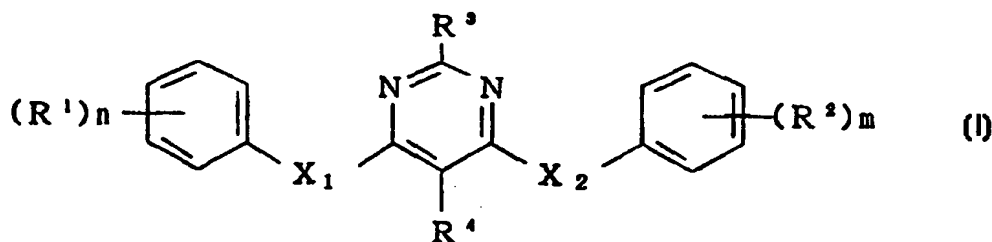
PCT

特許協力条約に基づいて公開された国際出願

|   |           |   |
|---|-----------|---|
| <p>(51) 国際特許分類<br/>C07D 239/46, 239/47, 239/48, 239/52,<br/>A01N 43/54</p>  | <p>A1</p> | <p>(11) 国際公開番号<br/>WO98/54154</p> <p>(43) 国際公開日<br/>1998年12月3日(03.12.98)</p>  |
| <p>(21) 国際出願番号<br/>PCT/JP98/02329</p> <p>(22) 国際出願日<br/>1998年5月27日(27.05.98)</p> <p>(30) 優先権データ<br/>特願平9/154491 1997年5月28日(28.05.97) JP<br/>特願平9/310045 1997年10月24日(24.10.97) JP</p> <p>(71) 出願人 (米国を除くすべての指定国について)<br/>日本曹達株式会社(NIPPON SODA CO., LTD.)(JP/JP)<br/>〒100-8165 東京都千代田区大手町2丁目2番1号 Tokyo, (JP)</p> <p>(72) 発明者 ; および<br/>(75) 発明者 / 出願人 (米国についてのみ)<br/>浜本伊佐美(HAMAMOTO, Isami)(JP/JP)<br/>井堀洋一(IHORI, Yoichi)(JP/JP)<br/>高橋英光(TAKAHASHI, Hidemitsu)(JP/JP)<br/>中村武彦(NAKAMURA, Takehiko)(JP/JP)<br/>岩佐孝男(IWASA, Takao)(JP/JP)<br/>〒250-0280 神奈川県小田原市高田345<br/>日本曹達株式会社 小田原研究所内 Kanagawa, (JP)</p> |           | <p>(74) 代理人<br/>東海裕作(TOKAI, Yusaku)<br/>〒100-8165 東京都千代田区大手町2丁目2番1号<br/>日本曹達株式会社内 Tokyo, (JP)</p> <p>(81) 指定国 AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, CA, CH, CN, CU, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, GB, GE, GH, GM, GW, HU, ID, IL, IS, JP, KE, KG, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MD, MG, MK, MN, MW, MX, NO, NZ, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TR, TT, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZW, ARIPO特許 (GH, GM, KE, LS, MW, SD, SZ, UG, ZW), ユーラシア特許 (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), 欧州特許 (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE), OAPI特許 (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, ML, MR, NE, SN, TD, TG).</p> <p>添付公開書類<br/>国際調査報告書</p> |

(54)Title: PYRIMIDINE COMPOUNDS, PROCESS FOR PRODUCING THE SAME, AND PESTICIDES

(54)発明の名称 ピリミジン化合物、その製法及び有害生物防除剤

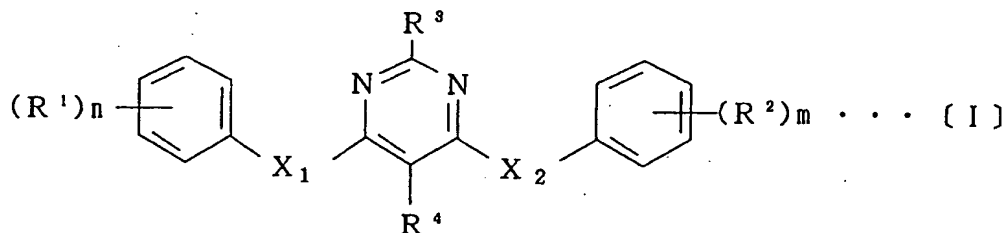


(57) Abstract

Novel compounds having a pyrimidine skeleton represented by general formula (I) or salts thereof and pesticides containing the same as the active ingredients, wherein R<sup>1</sup> and R<sup>2</sup> each independently represents halogeno, C<sub>1-6</sub> alkyl, C<sub>1-6</sub> haloalkyl, etc.; n and m represent each an integer of from 1 to 5; R<sup>3</sup> represents hydrogen, halogeno, C<sub>1-4</sub> alkyl or C<sub>1-4</sub> haloalkyl; R<sup>4</sup> represents NR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>, N=CR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>, isocyanato or isothiocyanato; and X<sub>1</sub> and X<sub>2</sub> each independently represents oxygen or N(R<sup>11</sup>).

(57)要約

本発明は、新規なピリミジン骨格を有する化合物、その製造法及び該化合物を有効成分として含有する有害生物防除剤に関し、詳しくは、式〔1〕



〔式中、R<sup>1</sup> および R<sup>2</sup> は、それぞれ独立して、ハロゲン原子、C<sub>1-6</sub> アルキル基、C<sub>1-6</sub> ハロアルキル基等を表し、n および m は 1 ～ 5 の整数を表し、R<sup>3</sup> は、水素原子、ハロゲン原子、C<sub>1-4</sub> アルキル基または C<sub>1-4</sub> ハロアルキル基を表し、R<sup>4</sup> は、式：NR<sup>5</sup> R<sup>6</sup> もしくは式：N = CR<sup>7</sup> R<sup>8</sup> で表される基、イソシアネート基またはイソチオシアネート基を表し、X<sub>1</sub> 及び X<sub>2</sub> はそれぞれ独立して、酸素原子または 式 N(R<sup>11</sup>) を表す。〕で表される化合物またはその塩、および該化合物を有効成分として含有する有害生物防除剤である。

PCTに基づいて公開される国際出願のパンフレット第一頁に掲載されたPCT加盟国を同定するために使用されるコード(参考情報)

|    |              |    |           |    |                |    |            |
|----|--------------|----|-----------|----|----------------|----|------------|
| AL | アルバニア        | FI | フィンランド    | LR | リベリア           | SK | スロヴァキア     |
| AM | アルメニア        | FR | フランス      | LS | レソト            | SL | シエラ・レオネ    |
| AT | オーストリア       | GA | ガボン       | LT | リトアニア          | SN | セネガル       |
| AU | オーストラリア      | GB | 英国        | LU | ルクセンブルグ        | SZ | スワジランド     |
| AZ | アゼルバイジャン     | GD | グレナダ      | LV | ラトヴィア          | TD | チャード       |
| BA | ボスニア・ヘルツェゴビナ | GE | グルジア      | MC | モナコ            | TG | トーゴ        |
| BB | バルバドス        | GH | ガーナ       | MD | モルドヴァ          | TJ | タジキスタン     |
| BE | ベルギー         | GM | ガンビア      | MG | マダガスカル         | TM | トルクメニスタン   |
| BF | ブルキナ・ファソ     | GN | ギニア       | MK | マケドニア旧ユーゴスラヴィア | TR | トルコ        |
| BG | ブルガリア        | GW | ギニア・ビサウ   |    | 共和国            | TT | トリニダード・トバゴ |
| BJ | ベナン          | GR | ギリシャ      | ML | マリ             | UA | ウクライナ      |
| BR | ブラジル         | HR | クロアチア     | MN | モンゴル           | UG | ウガンダ       |
| BY | ベラルーシ        | HU | ハンガリー     | MR | モーリタニア         | US | 米国         |
| CA | カナダ          | ID | インドネシア    | MW | マラウイ           | UZ | ウズベキスタン    |
| CF | 中央アフリカ       | IE | アイルランド    | MX | メキシコ           | VN | ヴェトナム      |
| CG | コンゴ          | IL | イスラエル     | NE | ニジェール          | YU | ユーゴスラビア    |
| CH | スイス          | IS | アイスランド    | NL | オランダ           | ZW | ジンバブエ      |
| CI | コートジボアール     | IT | イタリア      | NO | ノルウェー          |    |            |
| CM | カメルーン        | JP | 日本        | NZ | ニュージーランド       |    |            |
| CN | 中国           | KE | ケニア       | PL | ポーランド          |    |            |
| CU | キューバ         | KR | 韓国        | PT | ポルトガル          |    |            |
| CY | キプロス         | KZ | カザフスタン    | RO | ルーマニア          |    |            |
| CZ | チェコスロ        | LC | セントルシア    | RU | ロシア            |    |            |
| DE | ドイツ          | LI | リヒテンシュタイン | SD | スーダン           |    |            |
| DK | デンマーク        | LK | スリ・ランカ    | SE | スウェーデン         |    |            |
| EE | エストニア        |    |           | SG | シンガポール         |    |            |
| ES | スペイン         |    |           | SI | スロヴェニア         |    |            |

## 明 細 書

## ピリミジン化合物、その製法及び有害生物防除剤

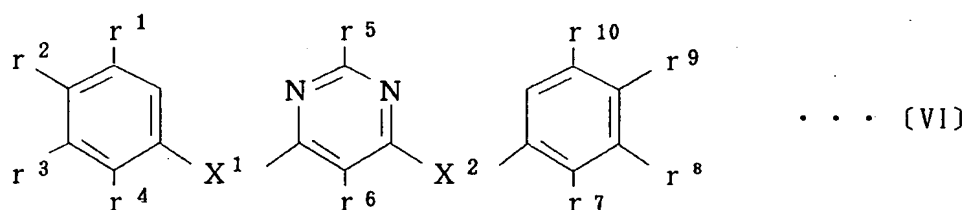
## 技術分野：

本発明は、新規なピリミジン骨格を有する化合物及び該化合物を有効成分として含有する有害生物防除剤に関する。

## 背景技術：

従来より、多数の殺虫剤、殺ダニ剤が使用されているが、その効力が不十分であったり、薬剤抵抗性問題等によりその使用が制限されたりすることから、必ずしも満足すべき防除薬剤とは言い難いものが少なくない。従って、かかる欠点の少ない安全に使用できる薬剤の開発が要望されている。

本発明に関連した化合物として、WO 94/02470号公報には下記の化合物が記載されている。

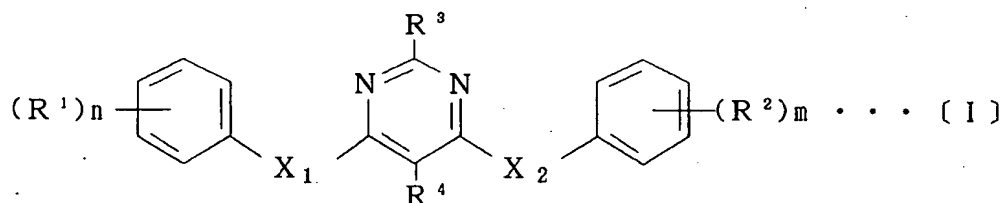


(式中、 $r^1 \sim r^8$  は水素原子、ハロゲン原子、アルキル基、ハロアルキル基等を表し、 $X^1$ 、 $X^2$  は酸素原子、硫黄原子、 $Nr^9$  等を表す。)

しかしながら、上記公報には、式中  $r^6$  がアミノ基およびその誘導体である化合物は何ら記載されていない。

## 発明の開示：

本発明は、下記式 (I)



(式中、 $R^1$  および  $R^2$  は、それぞれ独立して、ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、 $C_{1-6}$  アルキル基、 $C_{1-6}$  ハロアルキル基、 $C_{1-6}$  アルコキシ基、 $C_{1-6}$

$R^6$  ハロアルコキシ基、 $C_{1-6}$  アルキルチオ基、 $C_{1-6}$  アルキルスルフィニル基、 $C_{1-6}$  アルキルスルホニル基、 $C_{1-6}$  ハロアルキルチオ基、 $C_{1-6}$  ハロアルキルスルフィニル基、 $C_{1-6}$  ハロアルキルスルホニル基、（ハロゲン原子、 $C_{1-6}$  アルキル基もしくは $C_{1-6}$  ハロアルキル基で置換されていてもよい）フェノキシ基または、（ハロゲン原子、 $C_{1-6}$  アルキル基もしくは $C_{1-6}$  ハロアルキル基で置換されていてもよい）ピリジルオキシ基を表し、 $n$  および  $m$  は 1 ～ 5 の整数を表す。但し、 $n$  が 2 以上の整数を表すとき、 $R^1$  は同一でも相異なってもよく、 $m$  が 2 以上の整数を表すとき、 $R^2$  は同一でも相異なってもよい。

$R^3$  は、水素原子、ハロゲン原子、 $C_{1-4}$  アルキル基または  $C_{1-4}$  ハロアルキル基を表す。

$R^4$  は、式： $NR^5R^6$  もしくは式： $N=CR^7R^8$  で表される基、イソシアネート基またはイソチオシアネート基を表す。

$R^5$  および  $R^6$  はそれぞれ独立して、水素原子、ホルミル基、ヒドロキシ基、（ハロゲン原子、シアノ基、 $C_{3-6}$  シクロアルキル基、 $C_{1-6}$  アルコキシ基、 $C_{1-6}$  ハロアルコキシ基、 $C_{1-6}$  アルキルカルボニル基、 $C_{1-6}$  アルコキシカルボニル基、 $C_{1-6}$  アルキルカルボニルオキシ基もしくはカルボキシル基で置換されていてもよい） $C_{1-6}$  アルキル基、 $C_{2-6}$  アルケニル基、 $C_{2-6}$  アルキニル基、 $C_{2-6}$  ハロアルケニル基、 $C_{2-6}$  ハロアルキニル基、 $C_{1-6}$  アルコキシ基、 $C_{2-6}$  アルケニルオキシ基、 $C_{2-6}$  アルキニルオキシ基、 $C_{1-6}$  ハロアルコキシ基、 $C_{1-6}$  アルキルカルボニルオキシ基、 $C_{1-6}$  ハロアルキルカルボニルオキシ基、式： $COR^9$ （ $R^9$  は、 $C_{1-10}$  アルキル基、 $C_{1-6}$  ハロアルキル基、 $C_{1-6}$  ヒドロキシアルキル基、 $C_{1-6}$  アルコキシ基、 $C_{2-6}$  アルケニルオキシ基、 $C_{2-6}$  アルキニルオキシ基、 $C_{1-6}$  アルコキシ  $C_{1-6}$  アルキル基、 $C_{1-6}$  アルコキシカルボニル基、 $C_{1-6}$  アルキルカルボニルオキシ  $C_{1-6}$  アルキル基、（ $C_{1-6}$  アルキル基もしくはハロゲン原子で置換されていてもよい）フェニル基、（ハロゲン原子、 $C_{1-6}$  アルキル基、 $C_{1-6}$  ハロアルキル基で置換されていてもよい）ピラゾリル基、 $C_{1-6}$  アルキルアミノ基、ジ  $C_{1-6}$  アルキルアミノ基、フェニルアミノ基またはモルホリノ基を表す。）または 式： $S(O)_kR^{10}$ （ $R^{10}$  は  $C_{1-6}$  アルキル基、 $C_{1-6}$  ハロアルキル基、（ $C_{1-6}$  アルキル基もしくはハロゲン原子

で置換されていてもよい) フェニル基を表し、 $k$  は 0、1 または 2 を表す。) を表し、また、 $N$ 、 $R^5$  及び  $R^6$  が一緒になって環を形成してもよい。

$R^7$  および  $R^8$  は、それぞれ独立して、水素原子、 $C_{1-6}$  アルキル基、 $C_{1-6}$  アルコキシ基、 $C_{1-6}$  アルキルチオ基、アミノ基、 $C_{1-6}$  アルキルアミノ基、ジ  $C_{1-6}$  アルキルアミノ基または ( $C_{1-6}$  アルキル基もしくはハロゲン原子で置換されていてもよい) フェニル基を表す。

$X_1$  及び  $X_2$  はそれぞれ独立して、酸素原子または 式:  $N(R^{11})$  を表し、 $R^{11}$  は、水素原子、 $C_{1-6}$  アルキル基、 $C_{2-6}$  アルケニル基、 $C_{2-6}$  アルキニル基、 $C_{1-6}$  アルコキシ  $C_{1-6}$  アルキル基、ジ  $C_{1-6}$  アルキルカルバモイル基、 $CO R^{12}$  ( $R^{12}$  は、水素原子、 $C_{1-6}$  アルキル基、 $C_{1-6}$  アルコキシ基、または、ハロゲン原子、 $C_{1-6}$  アルキル基、 $C_{1-6}$  アルコキシ基もしくはニトロ基で置換されていてもよい) フェニル基を表す。) または  $SO_k R^{13}$  ( $R^{13}$  は  $C_{1-6}$  アルキル基、 $C_{2-6}$  アルケニル基、 $C_{2-6}$  アルキニル基を表し、 $k$  は 0、1 または 2 を表す) を表す。) で表される化合物またはその塩、それらの製法および該化合物の 1 種または 2 種以上を有効成分として含有することを特徴とする有害生物防除剤である。

前記式〔I〕で表されるピリミジン骨格を有する本発明化合物において、

$R^1$  および  $R^2$  におけるハロゲン原子としては、フッ素、塩素、臭素およびヨウ素が挙げられ、 $C_{1-6}$  アルキル基としては、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、 $t$ -ブチル等が挙げられ、 $C_{1-6}$  ハロアルキル基としては、フルオロメチル、クロロメチル、ブロモメチル、ジフルオロメチル、ジクロロメチル、ジブロモメチル、クロロフルオロメチル、ブロモフルオロメチル、クロロジフルオロメチル、ブロモジフルオロメチル、トリクロロメチル、トリフルオロメチル、クロロエチル、テトラフルオロエチル、トリフルオロエチル等が挙げられ、 $C_{1-6}$  アルコキシ基としては、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、イソプロポキシ、ブトキシ、 $t$ -ブトキシ等が挙げられ、 $C_{1-6}$  ハロアルコキシ基としては、フルオロメトキシ、クロロメトキシ、ブロモメトキシ、ジフルオロメトキシ、ジクロロメトキシ、ジブロモメトキシ、クロロフルオロメトキシ、ブロモフルオロメトキシ、クロロジフルオロメトキシ、ブロモジフルオロメトキシ、トリク

ロロメトキシ、トリフルオロメトキシ、クロロエトキシ、テトラフルオロエトキシ、トリフルオロエトキシトリフルオロメトキシ等が挙げられ、 $C_{1-6}$  アルキルチオ基としては、メチルチオ、エチルチオ、プロピルチオ、イソプロピルチオ等が挙げられ、 $C_{1-6}$  アルキルスルフィニル基としては、メチルスルフィニル、エチルスルフィニル、プロピルスルフィニル、イソプロピルスルフィニル等が挙げられ、 $C_{1-6}$  アルキルスルホニル基としては、メチルスルホニル、エチルスルホニル、プロピルスルホニル、イソプロピルスルホニル等が挙げられ、 $C_{1-6}$  ハロアルキルチオ基としては、フルオロメチルチオ、クロロメチルチオ、ブromoメチルチオ、ジフルオロメチルチオ、ジクロロメチルチオ、ジブromoメチルチオ、クロロフルオロメチルチオ、ブromoフルオロメチルチオ、クロロジフルオロメチルチオ、ブromoジフルオロメチルチオ、トリクロロメチルチオ、トリフルオロメチルチオ、クロロエチルチオ、テトラフルオロエチルチオ、トリフルオロエチルチオ等が挙げられ、 $C_{1-6}$  ハロアルキルスルフィニル基としては、フルオロメチルスルフィニル、クロロメチルスルフィニル、ブromoメチルスルフィニル、ジフルオロメチルスルフィニル、ジクロロメチルスルフィニル、ジブromoメチルスルフィニル、クロロフルオロメチルスルフィニル、ブromoフルオロメチルスルフィニル、クロロジフルオロメチルスルフィニル、ブromoジフルオロメチルスルフィニル、トリクロロメチルスルフィニル、トリフルオロメチルスルフィニル、クロロエチルスルフィニル、テトラフルオロエチルスルフィニル、トリフルオロエチルスルフィニル等が挙げられ、 $C_{1-6}$  ハロアルキルスルホニル基としては、フルオロメチルスルホニル、クロロメチルスルホニル、ブromoメチルスルホニル、ジフルオロメチルスルホニル、ジクロロメチルスルホニル、ジブromoメチルスルホニル、クロロフルオロメチルスルホニル、ブromoフルオロメチルスルホニル、クロロジフルオロメチルスルホニル、ブromoジフルオロメチルスルホニル、トリクロロメチルスルホニル、トリフルオロメチルスルホニル、クロロエチルスルホニル、テトラフルオロエチルスルホニル、トリフルオロエチルスルホニル等が挙げられ、フェノキシ基またはピリジロキシ基の置換基としては、フッ素、塩素、メチル、エチル、トリクロロメチル、トリフルオロメチル等が挙げられる。

$R^3$  におけるハロゲン原子としては、フッ素、塩素、臭素およびヨウ素が挙げ

られ、C<sub>1-6</sub> アルキル基としては、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、t-ブチル等が挙げられ、C<sub>1-6</sub> ハロアルキル基としては、フルオロメチル、クロロメチル、トリクロロメチル、トリフルオロメチル、クロロエチル、テトラフルオロエチル、トリフルオロエチル等が挙げられる。

R<sup>5</sup> 及び R<sup>6</sup> における置換されていてもよいアルキル基としては、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、t-ブチル、ペンチル、ヘキシル等の C<sub>1-6</sub> アルキル基；フルオロメチル、クロロメチル、ブロモメチル、ジフルオロメチル、ジクロロメチル、ジブロモメチル、クロロフルオロメチル、ブロモフルオロメチル、クロロジフルオロメチル、ブロモジフルオロメチル、トリクロロメチル、トリフルオロメチル、クロロエチル、テトラフルオロエチル、トリフルオロエチル等の C<sub>1-6</sub> ハロアルキル基；シアノメチル基、シアノエチル基等のシアノ C<sub>1-6</sub> アルキル基、シクロプロピルメチル、シクロプロピルエチル、シクロペンチルメチル、シクロヘキシルメチル等の C<sub>3-6</sub> シクロアルキル C<sub>1-6</sub> アルキル基；メトキシメチル、エトキシメチル、プロポキシメチル、イソプロポキシメチル、メトキシエチル、エトキシエチル、プロポキシエチル、イソプロポキシエチル等の C<sub>1-6</sub> アルコキシ C<sub>1-6</sub> アルキル基；フルオロメトキシメチル、クロロメトキシメチル、ブロモメトキシエチル、ジフルオロメトキシメチル、ジクロロメトキシエチル、ジブロモメトキシメチル、クロロフルオロメトキシメチル、ブロモフルオロメトキシメチル、クロロジフルオロメトキシメチル、ブロモジフルオロメトキシメチル、トリクロロメトキシメチル、トリフルオロメトキシメチル、クロロエトキシメチル、テトラフルオロエトキシエチル、トリフルオロエトキシメチル、トリフルオロメトキシメチル等の C<sub>1-6</sub> ハロアルコキシ C<sub>1-6</sub> アルキル基；アセチルメチル、プロピオニルメチル、ブチリルメチル、イソブチリルメチル、バレリルメチル、ピバロイルメチル、ペンチルカルボニルメチル、ヘキシルカルボニルメチル、アセチルエチル、プロピオニルエチル等の C<sub>1-6</sub> アルキルカルボニル C<sub>1-6</sub> アルキル基；メトキシカルボニルメチル、エトキシカルボニルメチル、プロポキシカルボニルメチル、イソプロポキシカルボニルメチル、メトキシカルボニルエチル等の C<sub>1-6</sub> アルコキシカルボニル C<sub>1-6</sub> アルキル基；アセトキシメチル、プロピオニルオキシメチル、ブチリルオキシメチル、イソブチリル

オキシメチル、アセトキシエチル等の  $C_{1-6}$  アルキルカルボニルオキシ  $C_{1-6}$  アルキル基；ヒドルオキシカルボニルメチル、ヒドロキシカルボニルエチル等のヒドロキシカルボニル  $C_{1-6}$  アルキル基が挙げられる。

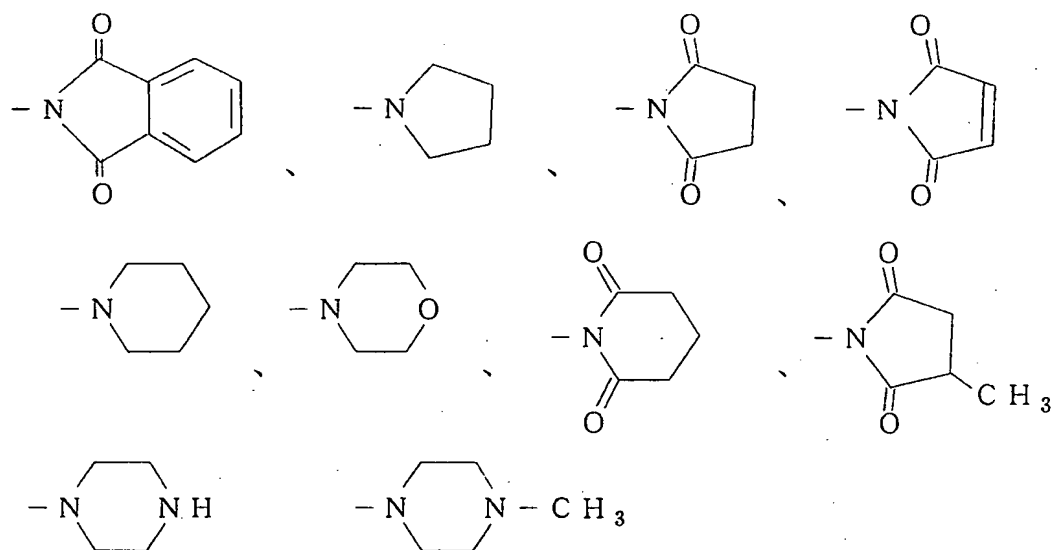
$C_{2-6}$  アルケニル基としては、ビニル、1-プロペニル、2-プロペニル、1-ブテニル、2-ブテニル、3-ブテニル、ブタジエニル等が挙げられ、 $C_{2-6}$  アルキニル基としては、エチニル、プロパルギル等が挙げられ、 $C_{2-6}$  ハロアルケニル基としては、3-クロロ-1-プロペニル、2-クロロ-1-プロペニル、3-クロロ-2-プロペニル、2-クロロ-2-プロペニル等が挙げられ、 $C_{2-6}$  ハロアルキニル基としては、クロロエチニル、1-クロロプロパルギル等が挙げられ、 $C_{1-6}$  アルコキシ基としては、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、イソプロポキシ、ブトキシ、t-ブトキシ等が挙げられ、 $C_{2-6}$  アルケニルオキシ基としては、ビニルオキシ、1-プロペニルオキシ、2-プロペニルオキシ、1-ブテニルオキシ、2-ブテニルオキシ、3-ブテニルオキシ、ブタジエニルオキシ等が挙げられ、 $C_{2-6}$  アルキニルオキシ基としては、エチニルオキシ、プロパルギルオキシ等が挙げられ、 $C_{1-6}$  ハロアルコキシ基としては、フルオロメトキシ、クロロメトキシ、ブロモメトキシ、ジフルオロメトキシ、ジクロロメトキシ、ジブロモメトキシ、クロロフルオロメトキシ、ブロモフルオロメトキシ、クロロジフルオロメトキシ、ブロモジフルオロメトキシ、トリクロロメトキシ、トリフルオロメトキシ、クロロエトキシ、テトラフルオロエトキシ、トリフルオロエトキシトリフルオロメトキシ等が挙げられ、 $C_{1-6}$  アルキルカルボニルオキシ基としては、アセトキシ、プロピオニルオキシ、ブチリルオキシ、イソブチリルオキシ、バレリルオキシ、ピバロイルオキシ、ペンチルカルボニルオキシ、ヘキシルカルボニルオキシ等が挙げられ、 $C_{1-6}$  ハロアルキルカルボニルオキシ基としては、フルオロアセトキシ、クロロアセトキシ、ブロモアセトキシ、ジフルオロアセトキシ、ジクロロアセトキシ、ジブロモアセトキシ、クロロフルオロアセトキシ、ブロモフルオロアセトキシ、クロロジフルオロアセトキシ、ブロモジフルオロアセトキシ、トリクロロアセトキシ、トリフルオロアセトキシ、クロロプロピオニルオキシ、テトラフルオロプロピオニルオキシ、トリフルオロプロピオニルオキシ等があげられる。



また、 $R^9$  において、 $C_{1-10}$ アルキル基としては、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、*t*-ブチル、ペンチル、ヘキシル、ヘプチル、オクチル、ノニル、デシル等が挙げられ、 $C_{1-6}$ ハロアルキル基としては、フルオロメチル、クロロメチル、ブromoメチル、ジフルオロメチル、ジクロロメチル、ジブromoメチル、クロロフルオロメチル、ブromoフルオロメチル、クロロジフルオロメチル、ブromoジフルオロメチル、トリクロロメチル、トリフルオロメチル、クロロエチル、ブromoエチル、テトラフルオロエチル、トリフルオロエチル等が挙げられ、ヒドロキシ $C_{1-6}$ アルキル基としては、ヒドロキシメチル、ヒドロキシエチル、ヒドロキシプロピル、ヒドロキシブチル等が挙げられ、 $C_{1-6}$ アルコキシ基としては、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、イソプロポキシ、ブトキシ、*t*-ブトキシ等が挙げられ、 $C_{2-6}$ アルケニルオキシ基としては、ビニルオキシ、1-プロペニルオキシ、2-プロペニルオキシ、1-ブテニルオキシ、2-ブテニルオキシ、3-ブテニルオキシ、ブタジエニルオキシ等が挙げられ、 $C_{2-6}$ アルキニルオキシ基としては、エチニルオキシ、プロパルギルオキシ等が挙げられ、 $C_{1-6}$ アルコキシ $C_{1-6}$ アルキル基としては、メトキシメチル、エトキシメチル、プロポキシメチル、イソプロポキシメチル、メトキシエチル、エトキシエチル、プロポキシエチル、イソプロポキシエチル等が挙げられ、 $C_{1-6}$ アルコキシカルボニル基としては、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、プロポキシカルボニル、イソプロポキシカルボニル、メトキシカルボニル等が挙げられ、 $C_{1-6}$ アルキルカルボニルオキシ $C_{1-6}$ アルキル基としては、アセトキシメチル、プロピオニルオキシメチル、ブチリルオキシメチル、アセトキシエチル等が挙げられ、置換されていてもよいフェニル基としては、4-クロロフェニル、3-クロロフェニル、2-クロロフェニル、4-メチルフェニル、4-イソプロピルフェニル、4-*t*-ブチルフェニル等が挙げられ、置換されていてもよいピラゾリル基としては、1-メチル-3-トリフルオロメチル-5-クロロ-4-ピラゾリル、1-メチル-3, 5-ジクロロ-4-ピラゾリル等が挙げられ、モノまたはジ $C_{1-6}$ アルキルアミノ基としては、メチルアミノ、エチルアミノ、プロピルアミノ、イソプロピルアミノ、ブチルアミノ、*t*-ブチルアミノ、ペンチルアミノ、ヘキシルアミノ、ジメチルアミノ、ジエチルアミノ、ジプロピルアミノ、

ジイソプロピルアミノ、ジブチルアミノ等が挙げられる。また、式：S (O)  
 $k R^{10}$  における  $R^{10}$  としては、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、*t*-ブチル、ペンチル、ヘキシル等の  $C_{1-6}$  アルキル基；フルオロメチル、クロロメチル、ブromoメチル、ジフルオロメチル、ジクロロメチル、ジブromoメチル、クロロフルオロメチル、ブromoフルオロメチル、クロロジフルオロメチル、ブromoジフルオロメチル、トリクロロメチル、トリフルオロメチル、クロロエチル、テトラフルオロエチル、トリフルオロエチル等の  $C_{1-6}$  ハロアルキル基；フェニル、4-メチルフェニル、4-クロロフェニル、3-クロロフェニル等の置換されていてもよいフェニル基が挙げられる。

N、 $R^5$  及び  $R^6$  が一緒になって形成してもよい環としては、



等のヘテロ環が挙げられる。

式：N = C  $R^7 R^8$  において、 $R^7$  および  $R^8$  の  $C_{1-6}$  アルキル基としては、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル基等が挙げられ、 $C_{1-6}$  アルコキシ基としては、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、イソプロポキシ、ブトキシ、*t*-ブトキシ等が挙げられ、 $C_{1-6}$  アルキルチオ基としては、メチルチオ、エチルチオ、プロピルチオ、イソプロピルチオ等が挙げられ、モノまたはジ  $C_{1-6}$  アルキルアミノ基としては、メチルアミノ、エチルアミノ、プロピルアミノ、イソプロ

ピルアミノ、ブチルアミノ、*t*-ブチルアミノ、ペンチルアミノ、ヘキシルアミノ、ジメチルアミノ、ジエチルアミノ、ジプロピルアミノ、ジイソプロピルアミノ、ジブチルアミノ等が挙げられる。さらに、置換されていてもよいフェニル基としては、フェニル、4-クロロフェニル、4-メチルフェニル、4-*t*-ブチルフェニル等が挙げられる。

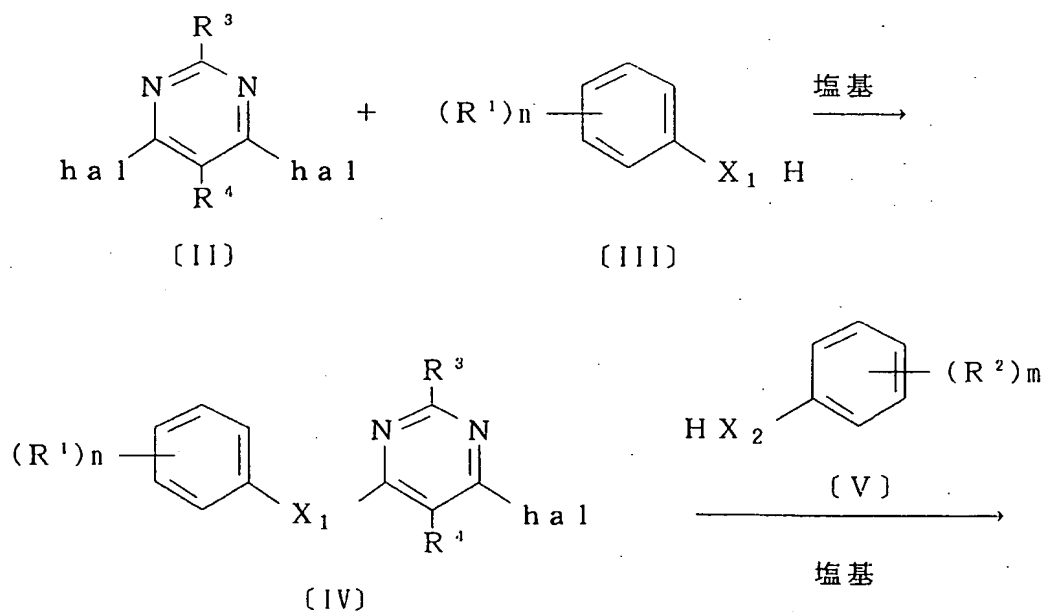
$X_1$  及び  $X_2$  において、 $R^{11}$  は、水素原子、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル基、ブチル、*t*-ブチル、ペンチル、ヘキシル基等の  $C_{1-6}$  アルキル基、ビニル、アリル、クロチル基等の  $C_{1-6}$  アルケニル基、エチニル、プロパルギル基等の  $C_{1-6}$  アルキニル基、アセチル、プロピオニル、ベンゾイル、4-クロロベンゾイル基、4-メチルベンゾイル基等の  $CO R^{12}$  で表される基が挙げられる。

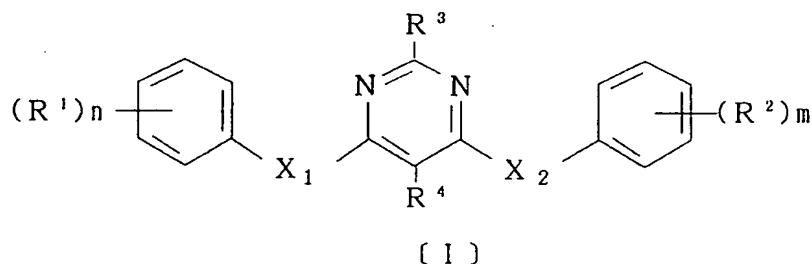
更に、本発明化合物において、 $R^1$  および  $R^2$  がハロゲン原子または  $C_{1-6}$  ハロアルキル基であり、 $n$  および  $m$  が 1 または 2 であり、 $R^4$  が  $NR^5 R^6$  である化合物は、その有害生物防除活性が特に優れている。

#### 〔化合物の製造〕

本発明化合物は、例えば、以下の様にして製造することができる。

#### 製造法 1





（式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $n$ 、 $m$ 、 $X_1$  及び  $X_2$  は前記と同じ意味を表し、 $hal$  はハロゲン原子を表す。）

すなわち、式〔II〕で表されるジクロロピリミジン等のジハロゲノピリミジンに、式〔III〕で表される化合物を、塩基の存在下に作用させて中間体〔IV〕を得たのち、次いで、式〔V〕で表される化合物を、塩基の存在下に反応させるものである。

これらの反応に用いることのできる塩基としては、例えば、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、ピリジン、1, 8-ジアザビシクロ〔5, 4, 0〕-7-ウンデセン（DBU）、炭酸カリウム、炭酸ナトリウム等の炭酸塩、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等の水酸化物、水素化ナトリウム等の水素化物、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、カリウム-*t*-ブトキシド等の金属アルコキシド等を挙げることができる。

また、これらの反応に用いることのできる溶媒としては、 $N$ 、 $N$ -ジメチルホルムアミド（DMF）、 $N$ 、 $N$ -ジメチルアセトアミド（DMA）、 $N$ -メチルピロリドン等のアミド類、テトラヒドロフラン（THF）、ジエチルエーテル等のエーテル類、メタノール、エタノール等のアルコール類、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、酢酸エチル等のエステル類、アセトニトリル等のニトリル類、ジメチルスルホキシド（DMSO）等を例示することができる。これらの反応は、 $0^{\circ}\text{C}$ から用いる溶媒の沸点の温度範囲で円滑に進行する。

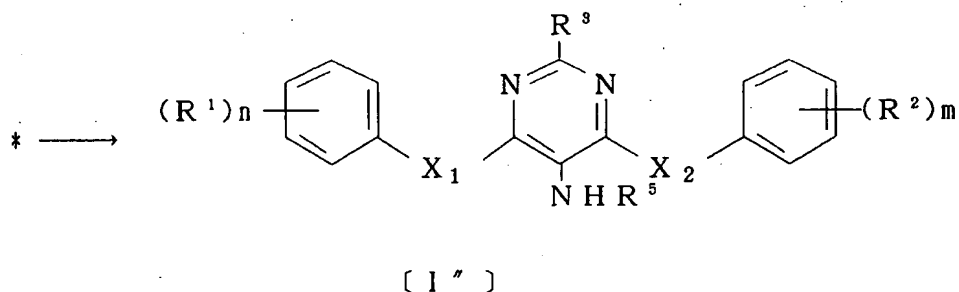
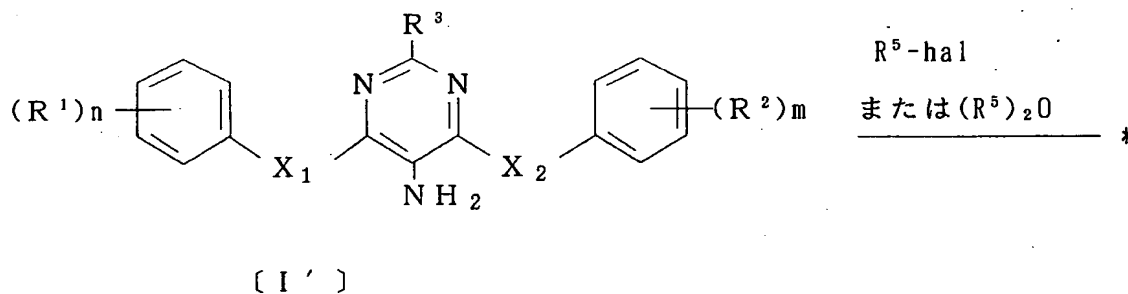
また、フェニル基の置換基及び $X_1$ と $X_2$ が同一の場合、式〔II〕で表されるジハロゲノピリミジン1モルには式〔III〕または式〔V〕で表される化合物を2モル反応させることにより、1工程で本発明化合物を製造することができる。

さらに、 $X_1$  または  $X_2$  の種類によっては反応系内にパラジウム等の触媒を塩基と同時に存在させることにより目的化合物を高収率で得られることもある。

この反応に用いることのできるパラジウム触媒としては、塩化パラジウム、ビス(トリフェニルホスフィン)ジクロロパラジウム、テトラキス(トリフェニルホスフィン)パラジウム、トリス(ジベンジリデンアセトン)ジパラジウム・クロロホルム付加物等を挙げることができる。触媒の量は、式〔IV〕で表されるハロピリミジン1モルに対し、1モル%~20モル%が好ましい。なお、パラジウム触媒を用いる場合には、トリフェニルホスフィン、トリ-*o*-トリルホスフィン等のトリアリールホスフィン等のリン化合物の共存下に反応させることもできる。

## 製造法 2

式〔I〕で表される化合物において  $R^4$  がアミノ基以外の化合物は以下の反応式に従って製造することもできる。



(式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^5$ 、 $n$ 、 $m$ 、 $X_1$ 、 $X_2$  及び  $hal$  は前記と同じ

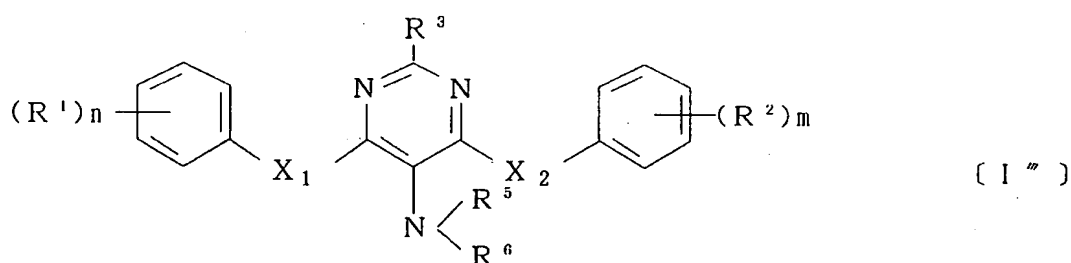
意味を表す。)

反応は塩基の存在下、有機溶媒中、 $-20^{\circ}\text{C}$ から用いる溶媒の沸点までの温度で数10分から数10時間行なわれる。

用いられる塩基としては、例えば、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、ピリジン、1, 8-ジアザビシクロ〔5, 4, 0〕-7-ウンデセン (DBU)、炭酸カリウム、炭酸ナトリウム等の炭酸塩、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等の水酸化物、水素化ナトリウム等の水素化物、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、カリウム-*t*-ブトキシド等の金属アルコキシド等を挙げることができる。

反応に用いられる溶媒としては、ジクロロメタン、クロロホルム等の塩素系溶媒、N, N-ジメチルホルムアミド (DMF)、N, N-ジメチルアセトアミド (DMA)、N-メチルピロリドン等のアミド類、テトラヒドロフラン (THF)、ジエチルエーテル等のエーテル類、メタノール、エタノール等のアルコール類、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、酢酸エチル等のエステル類、アセトニトリル等のニトリル類、ジメチルスルホキシド (DMSO) 等を例示することができる。

また、さらに、式〔I'〕で表される化合物に、 $\text{R}^6 \text{ hal}$ または $(\text{R}^6)_2\text{O}$  ( $\text{R}^6$ は前記と同様の意味を表す。)を同様に反応させることにより



で表される化合物を得ることができる。 $\text{R}^5$ と $\text{R}^6$ が同一の場合は1工程で得ることも可能である。

さらに $\text{R}^5$ または $\text{R}^6$ がアルキル基の場合 $(\text{R}^5)_2\text{SO}_4$ 、 $(\text{R}^6)_2\text{SO}_4$ 等のアルキル化剤でアルキル化することも可能である。

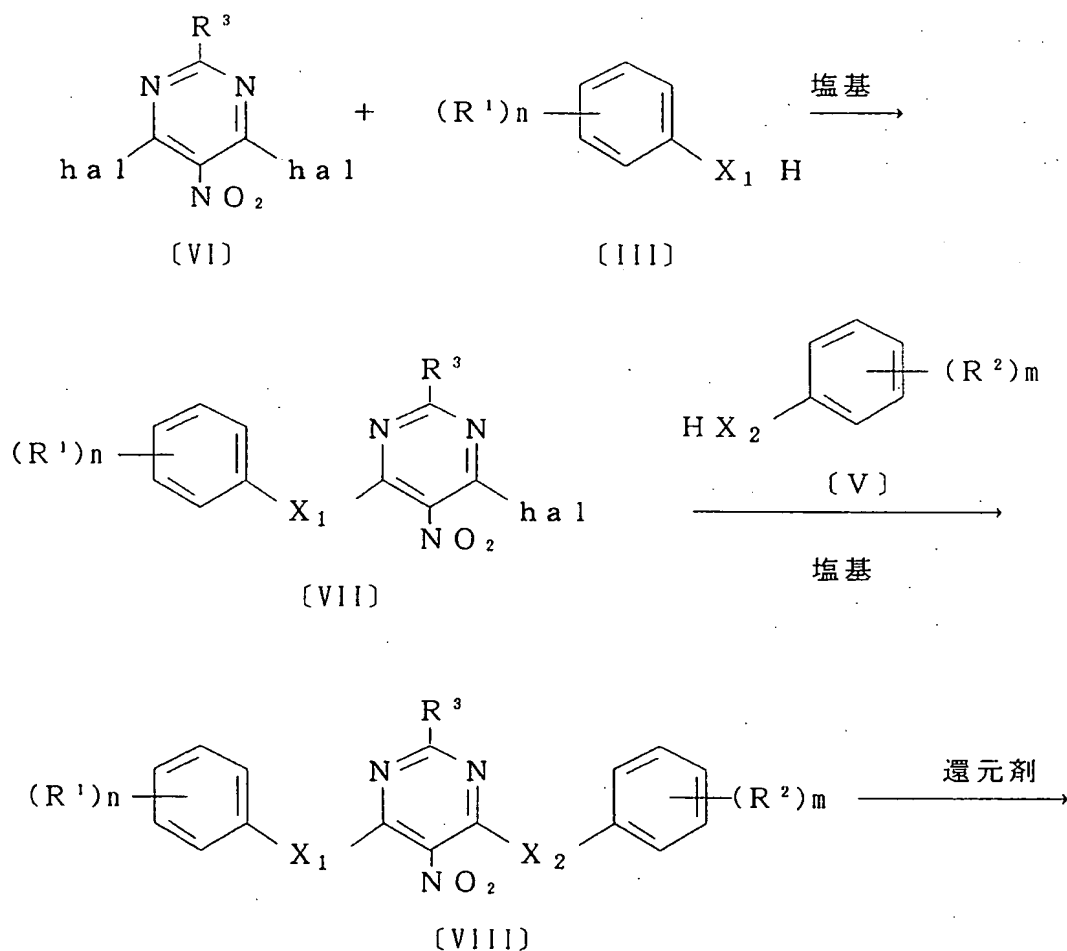
## 製造法 3

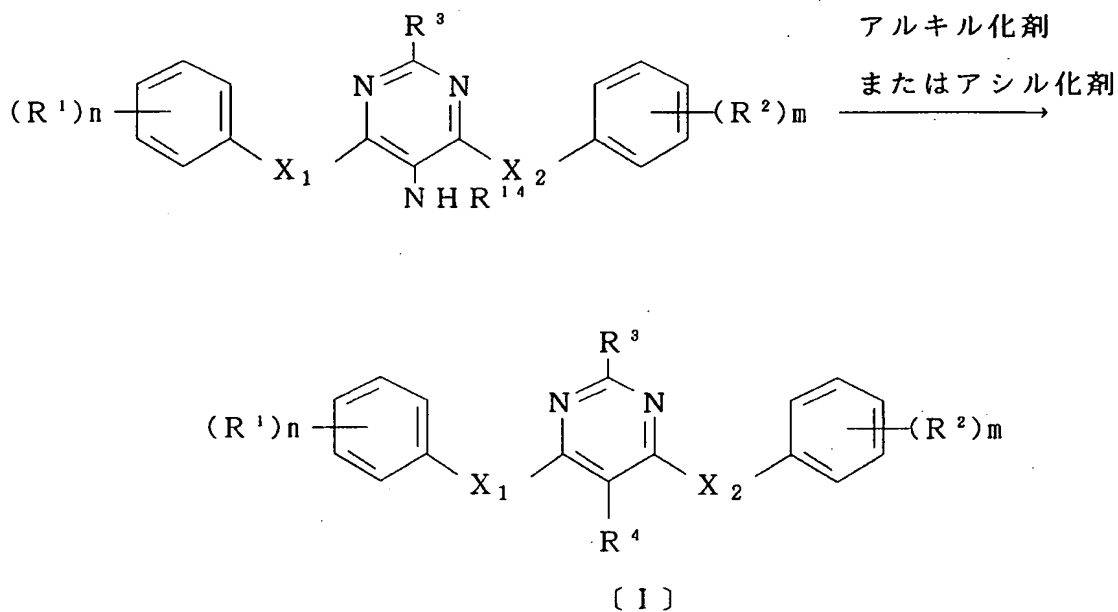
式〔I〕で表される化合物において、 $R^4$  が  $N=R^7 R^8$  である化合物は、前記式〔I'〕で表される化合物と、式： $R^7 C(=O)R^8$  で表されるカルボニル化合物との縮合反応により製造することができる。

この縮合反応には、触媒として、ベンゼンスルホン酸、塩化亜鉛、三フッ化ホウ素、四塩化チタンなどのルイス酸を使用することもできる。

## 製造法 4

式〔I〕で表される化合物において、 $R^4$  がアミノ基、ヒドロキシアミノ基およびヒドロキシアミノ基の誘導体である化合物は、以下の式に従って製造することができる。





(式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $n$ 、 $m$ 、 $X_1$ 、 $X_2$  及び  $hal$  は前記と同じ意味を表し、 $R^{1'}$  は水素原子または水酸基を表す。)

化合物〔VI〕と化合物〔V〕とは、製造法1に示した方法と同様にして反応させることができる。化合物〔VIII〕の還元反応は、通常の還元反応条件、すなわち、リチウムアルミニウムハイドレートなどの金属水素化物による還元、酸性条件下での亜鉛末やスズによる還元、白金やパラジウム-炭素などの遷移金属を触媒とする接触水素添加またはギ酸アンモニウムなどによる還元等が用いられる。

#### 製造法5

本発明化合物のうち $R^4$ がイソシアネート、イソチオシアネートである化合物は、前記式〔I'〕で表される化合物と、ホスゲン、チオホスゲンあるいはトリホスゲンなどのそれらの代替物とを反応させて製造することができる。

反応生成物の構造の同定は、NMR、IR、MASS等の各種スペクトルの測定により行なった。



## 〔殺虫・殺ダニ剤〕

本発明化合物は、農業上の有害生物、衛生害虫、貯穀害虫、衣類害虫、家屋害虫等の防除に使用でき、殺成虫、殺若虫、殺幼虫、殺卵作用を有する。その代表例として、下記のもものが挙げられる。

鱗翅目害虫、例えば、ハスモンヨトウ、ヨトウガ、タマナヤガ、アオムシ、タマナギンウワバ、コナガ、チャノコカクモンハマキ、チャハマキ、モモシンクイガ、ナシヒメシンクイ、ミカンハモグリガ、チャノホソガ、キンモンホソガ、マイマイガ、チャドクガ、ニカメイガ、コブノメイガ、ヨーロピアンコーンボラー、アメリカシロヒトリ、スジマダラメイガ、ヘリオティス属、ヘリコベルパ属、アグロティス属、イガ、コドリリング、ワタアカミムシ等、

半翅目害虫、例えば、モモアカアブラムシ、ワタアブラムシ、ニセダイコンアブラムシ、ムギクビレアブラムシ、ホソヘリカメムシ、アオクサカメムシ、ヤノネカイガラムシ、クワコナカイガラムシ、オンシツコナジラミ、タバココナジラミ、ナシキジラミ、ナシグンバイムシ、トビイロウンカ、ヒメトビウンカ、セジロウンカ、ツマグロヨコバイ等、

鞘翅目害虫、例えば、キスジノミムシ、ウリハムシ、コロラドハムシ、イネミズゾウムシ、コクゾウムシ、アズキゾウムシ、マメコガネ、ヒメコガネ、ジアプロティカ属、タバコシバンムシ、ヒラタキクイムシ、マツノマダラカミキリ、ゴマダラカミキリ、アグリオティス属、ニジュウヤホシテントウ、コクヌスト、ワタミゾウムシ等、

双翅目害虫、例えば、イエバエ、オオクロバエ、センチニクバエ、ウリミバエ、ミカンコミバエ、タネバエ、イネハモグリバエ、キイロショウジョウバエ、サシバエ、コガタアカイエカ、ネッタイシマカ、シナハマダラカ等、

総翅目害虫、例えば、ミナミキイロアザミウマ、チャノキイロアザミウマ等、

膜翅目害虫、例えば、イエヒメアリ、キイロスズメバチ、カブラハバチ等、

直翅目害虫、例えば、チャバネゴキブリ、ワモンゴキブリ、クロゴキブリ、トノサマバッタ等、

等翅目害虫、例えば、イエシロアリ、ヤマトシロアリ等、

隠翅目害虫、例えば、ヒトノミ等、シラミ目害虫、例えば、ヒトジラミ等、

ダニ類、例えば、ナミハダニ、カンザワハダニ、ミカンハダニ、リンゴハダニ、ミカンサビダニ、リンゴサビダニ、チャノホコリダニ、ブレビパルパス属、エオテトラニカス属、ロビンネダニ、ケナガコナダニ、コナヒョウヒダニ、オウシマダニ、フタトゲチマダニ等、

植物寄生性線虫類、例えば、サツマイモネコブセンチュウ、ネグサレセンチュウ、ダイズシストセンチュウ、イソシングレセンチュウ、マツノザイセンチュウ等。

又、近年コナガ、ウンカ、ヨコバイ、アブラムシ等多くの害虫において有機リン剤、カーバメート剤や殺ダニ剤に対する抵抗性が発達し、それら薬剤の効力不足問題を生じており、抵抗性系統の害虫やダニにも有効な薬剤が望まれている。本発明化合物は感受性系統のみならず、有機リン剤、カーバメート剤又はピレスロイド剤抵抗性系統の害虫や殺ダニ剤抵抗性系統のダニにも優れた殺虫殺ダニ効果を有する薬剤である。

また本発明化合物は薬害が少なく、魚毒、混血動物への毒性が低く、安全性の高い薬剤である。

本発明化合物は、水棲生物が船底、魚網等の水中接触物に付着するのを防止するための防汚剤として使用することも出来る。

このようにして得られた本発明化合物を実際に施用する際には他成分を加えず純粋な形で使用できるし、また農薬として使用する目的で一般の農薬のとり得る形態、即ち、水和剤、粒剤、粉剤、乳剤、水溶剤、懸濁剤、フロアブル等の形態で使用することもできる。添加剤および担体としては固型剤を目的とする場合は、大豆粒、小麦粉等の植物性粉末、珪藻土、燃灰石、石こう、タルク、ベントナイト、パイロフィライト、クレイ等の鉱物性微粉末、安息香酸ソーダ、尿素、芒硝等の有機及び無機化合物が使用される。液体の剤型を目的とする場合は、ケロシン、キレシンおよびソルベントナフサ等の石油留分、シクロヘキサン、シクロヘキサノン、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、アルコール、アセトン、トリクロルエチレン、メチルイソブチルケトン、鉱物油、植物油、水等を溶剤として使用する。これらの製剤において均一かつ安全な形態をとるために、必要ならば界面活性剤を添加することもできる。また有効成分量は好ましくは5

～70%である。このようにして得られた水和剤、乳剤、フロアブル剤は水で所定の濃度に希釈して懸濁液あるいは乳濁液として、粉剤・粒剤はそのまま散布する方法で使用される。

なお、本発明化合物は単独でも十分有効であることは言うまでもないが、各種の殺菌剤や殺虫・殺ダニ剤または共力剤の1種又は2種以上と混合して使用することも出来る。

本発明化合物と混合して使用出来る殺菌剤、殺虫剤、殺ダニ剤、植物生長調節剤の代表例を以下に示す。

殺菌剤：

キャプタン、フォルペット、チウラム、ジラム、ジネブ、マンネブ、マンコゼブ、プロピネブ、ポリカーバメート、クロロタロニル、キントーゼン、キャプタホル、イプロジオン、プロサイミドン、ビンクロゾリン、フルオロイミド、サイモキサニル、メプロニル、フルトラニル、ペンシクロン、オキシカルボキシ、ホセチルアルミニウム、プロパモカーブ、トリアジメホン、トリアジメノール、プロピコナゾール、ジクロブトラゾール、ビテルタノール、ヘキサコナゾール、マイクロブタニル、フルシラゾール、エタコナゾール、フルオトリマゾール、フルトリアフェン、ベンコナゾール、ジニコナゾール、サイプロコナゾール、フェナリモール、トリフルミゾール、プロクロラズ、イマザリル、ペフラゾエート、トリデモルフ、フェンプロピモルフ、トリホリン、ブチオベート、ピリフェノックス、アニラジン、ポリオキシ、メタラキシル、オキサジキシル、フララキシル、イソプロチオラン、プロベナゾール、ピロールニトリン、ブラストサイジンS、カスガマイシン、バリダマイシン、硫酸ジヒドロストレプトマイシン、ベノミル、カルペンダジム、チオファネートメチル、ヒメキサゾール、塩基性塩化銅、塩基性硫酸銅、フェンチンアセテート、水酸化トリフェニル錫、ジエトフェンカルブ、メタスルホカルブ、キノメチオナート、ビナパクリル、レシチン、重曹、ジチアノン、ジノカップ、フェナミノスルフ、ジクロメジン、グアザチン、ドジン、IBP、エディフェンホス、メパニピリム、フェルムゾン、トリクラミド、メタスルホカルブ、フルアジナム、エトキノラック、ジメトモルフ、ピロキロン、テクロフタラム、フサライド、フェナジンオキシド、チアベンダゾール、ト

リシクラゾール、ピンクロゾリン、シモキサニル、シクロブタニル、グアザチン、プロパモカルブ塩酸塩、オキシリニック酸。

殺虫・殺ダニ剤：

有機燐およびカーバメート系殺虫剤：

フェンチオン、フェントロチオン、ダイアジノン、クロルピリホス、ESP、バミドチオン、フェントエート、ジメトエート、ホルモチオン、マラソン、トリクロルホン、チオメトン、ホスメット、ジクロルボス、アセフェート、EPBP、メチルパラチオン、オキシジメトンメチル、エチオン、サリチオン、シアノホス、イソキサチオン、ピリダフェンチオン、サホロン、メチダチオン、スルプロホス、クロルフェンビンホス、テトラクロルビンホス、ジメチルビンホス、プロパホス、イソフェンホス、エチルチオメトン、プロフェノホス、ピラクロホス、モノクロトホス、アジンホスメチル、アルディカルブ、メソミル、チオジカルブ、カルボフラン、カルボスルファン、ベンフラカルブ、フラチオカルブ、プロボキスル、BPMC、MTMC、MIPC、カルバリル、ピリミカーブ、エチオフエンカルブ、フェノキシカルブ等。

ピレスロイド系殺虫剤：

ペルメトリン、シペルメトリン、デルタメスリン、フェンバレレート、フェンプロパトリン、ピレトリン、アレスリン、テトラメスリン、レスメトリン、ジメスリン、プロパスリン、フェノトリン、プロトリン、フルバリネート、シフルトリン、シハロトリン、フルシトリネート、エトフェンプロクス、シクロプロトリン、トロラメトリン、シラフルオフエン、プロフェンプロクス、アクリナトリン等。

ベンゾイルウレア系その他の殺虫剤：

ジフルベンズロン、クロルフルアズロン、ヘキサフルムロン、トリフルムロン、テトラベンズロン、フルフェノクスロン、フルシクロクスロン、ブプロフェジン、ピリプロキシフェン、メトブレン、ベンゾエピン、ジアフェンチウロン、アセタミプリド、イミダクロプリド、ニテンピラム、フィプロニル、カルタップ、チオシクラム、ベンスルタップ、硫酸ニコチン、ロテノン、メタアルデヒド、機械油、BTや昆虫病原ウイルスなどの微生物農薬等。

## 殺線虫剤：

フェナミホス、ホスチアゼート等。

## 殺ダニ剤：

クロルベンジレート、フェニソプロモレート、ジコホル、アミトラズ、B P P S、ベンゾメート、ヘキシチアゾクス、酸化フェンブタスズ、ポリナクチン、キノメチオネート、C P C B S、テトラジホン、アベルメクチン、ミルベメクチン、クロフェンテジン、シヘキサチン、ピリダベン、フェンピロキシメート、テブフェンピラド、ピリミジフェン、フェノチオカルブ、ジエノクロル等。

## 植物生長調節剤：

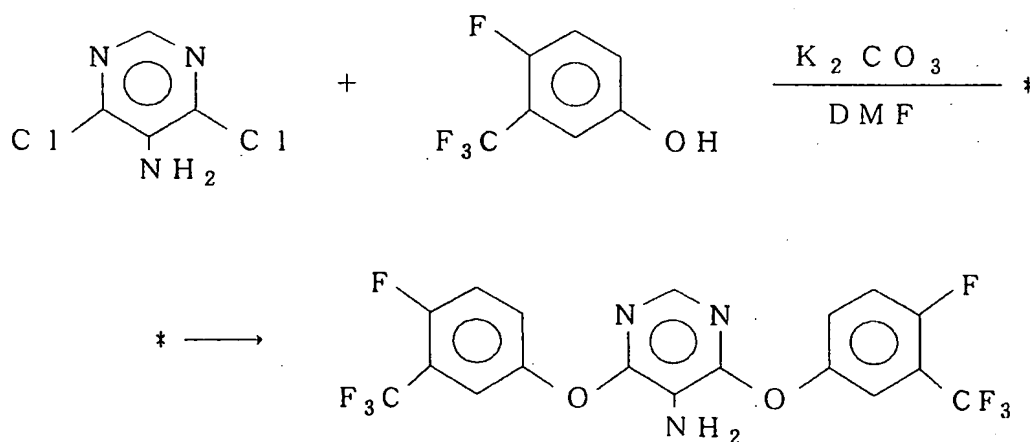
ジベレリン類（例えばジベレリンA<sub>3</sub>、ジベレリンA<sub>4</sub>、ジベレリンA<sub>7</sub>）I A A、N A A。

## 発明を実施するための最良の形態：

次に、実施例により、本発明を更に詳細に説明する。

## （実施例1）

5-アミノ-4,6-ビス（4-フルオロ-3-トリフルオロメチルフェノキシ）ピリミジン（化合物番号1）：



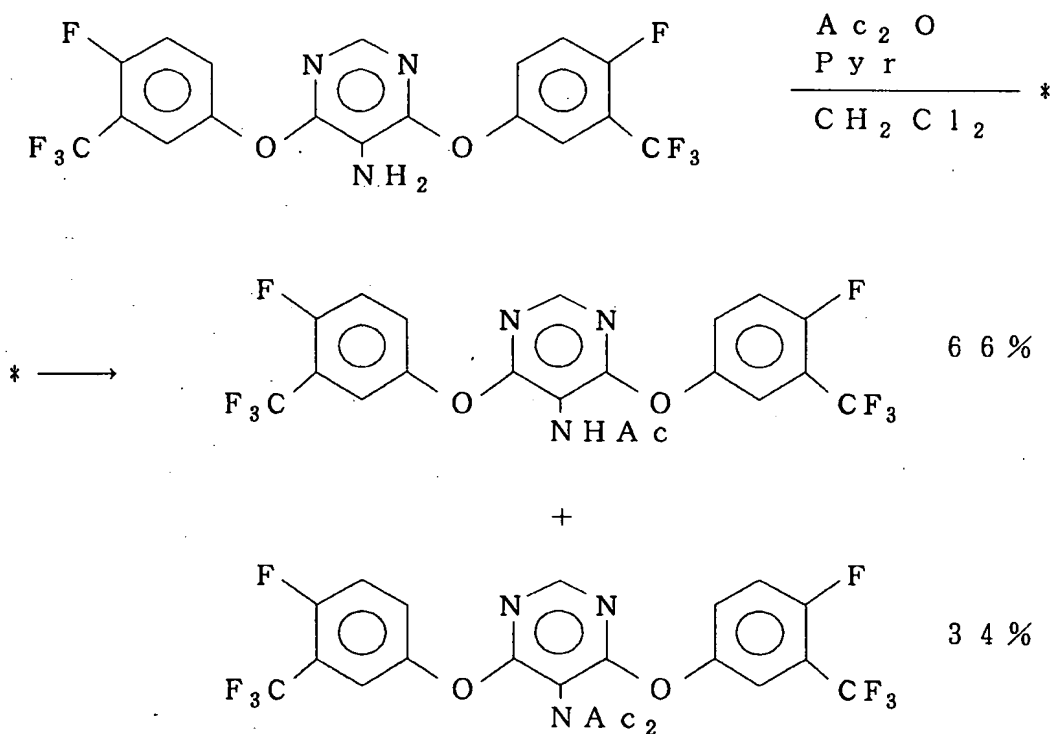
5-アミノ-4,6-ジクロロピリミジン 0.5 g、4-フルオロ-3-トリ

フルオロメチルフェノール 1. 6 g、炭酸カリウム 2. 45 g を DMF (10 ml) に加え、約 80 °C で 12 時間攪拌した。

反応混合物を食塩水にあけて酢酸エチルを抽出した。この時、生ずる不溶物をセライトを通してろ別し、ろ液の水層を酢酸エチルで 2 回抽出し、有機層をさらに水洗 (2 回) し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。濾過後、減圧濃縮し、残渣をシリカゲルクロマトグラフィーにより精製 (ヘキサン/酢酸エチル 4/1 で展開) し、1.28 g の目的物を得た。m. p. [75 - 79 °C]

(実施例 2)

5-アセチルアミノ-4,6-ビス(4-フルオロ-3-トリフルオロメチルフェトキシ)ピリミジン (化合物番号 10) 及び 4,6-ビス(4-フルオロ-3-トリフルオロメチルフェノキシ)-5-ジアセチルアミノピリミジン (化合物番号 31) :

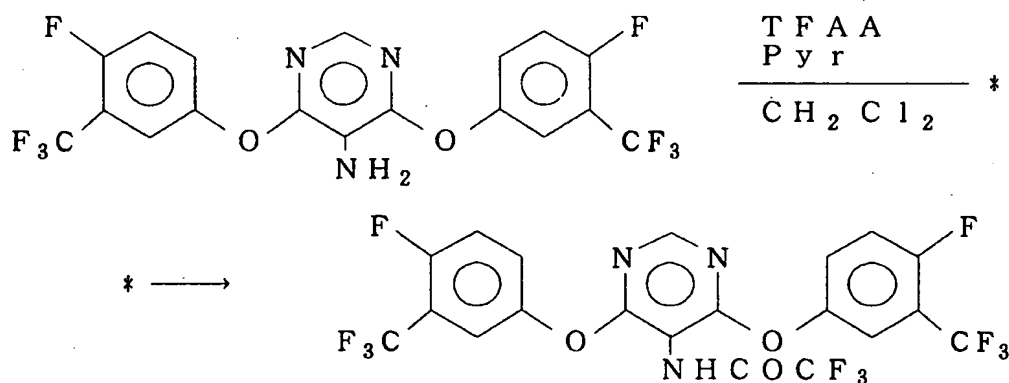


5-アミノ-4, 6-ビス(4-フルオロ-3-トリフルオロメチルフェノキシ)ピリミジン0.50g(1.1mmol)のジクロロメタン(5mL)溶液に、氷冷下において無水酢酸0.29g(2.8mmol)、およびピリジン0.31g(3.9mmol)を滴下した。その後、この混合物を室温まで昇温し、そのまま3日間攪拌したが、反応が未完結であったため、1日還流下で反応させた。その後、この混合物を室温まで冷却し、水中に注ぎ入れ、クロロホルムにより抽出した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥させ、濾過し、減圧濃縮した。

得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにより精製し、5-アセチルアミノ-4, 6-ビス(4-フルオロ-3-トリフルオロメチルフェノキシ)ピリミジン0.36g(66%)(m. p. 123-125°C)および4, 6-ビス(4-フルオロ-3-トリフルオロメチルフェノキシ)-5-ジアセチルアミノピリミジン0.20g(34%)(m. p. 138-139°C)を得た。

### (実施例3)

4, 6-ビス(4-フルオロ-3-トリフルオロメチルフェノキシ)-5-トリフルオロアセチルアミノピリミジン(化合物番号16)：



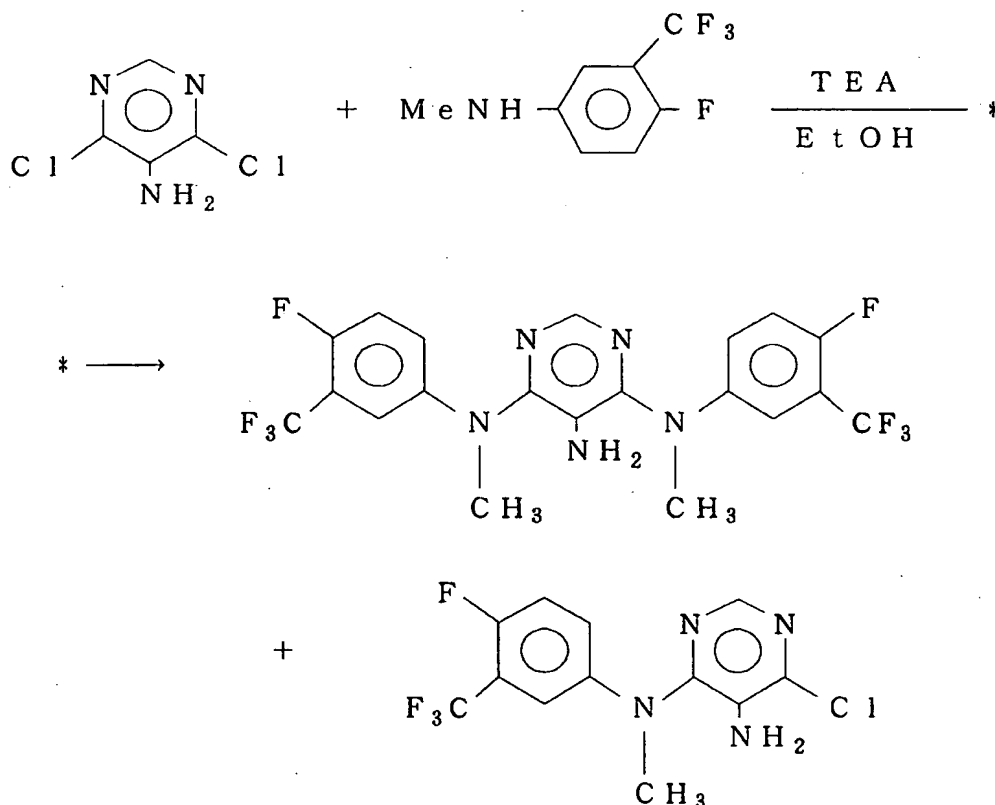
5-アミノ-4, 6-ビス(4-フルオロ-3-トリフルオロメチルフェノキシ)

シ) ピリミジン 1.0 g (2.2 mmol) のジクロロメタン (10 mL) 溶液を 0℃ に冷却し、トリフルオロ酢酸無水物 0.87 g (8.5 mmol) およびピリジン 0.92 g (12 mmol) を滴下しながら加えた。

この反応混合物を室温に昇温し、3日間攪拌した後、水中に注ぎ入れ、クロロホルムにより抽出した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥し、濾過し、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにより精製し、目的物を 1.26 g 得た。(m. p. 121–122℃)

(実施例 4)

5-アミノ-4,6-ビス(N-メチル-4-フルオロ-3-トリフルオロメチルアニリノ)ピリミジン(化合物番号706) :





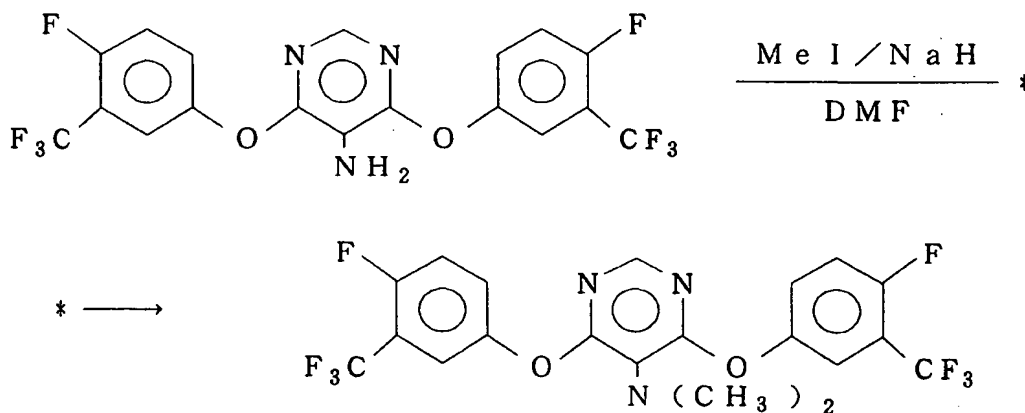
5-アミノ-4,6-ジクロロピリミジン 1.00 g (5.91 mmol)、N-メチル-4-フルオロ-3-トリフルオロメチルアニリン 1.26 g (6.52 mmol) およびトリエチルアミン 0.90 g (8.89 mmol) のエタノール 15 mL 溶液を還流下、6日間攪拌した。反応が未完結であったため、DBUを5滴加え、更に6日間還流下、反応させた。その後、室温まで冷却し、エタノールを減圧下留去し、残渣を水中に注ぎ入れエーテルにより抽出した。有機層を無水硫酸マグネシウムにより乾燥させ、濾過し、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにより精製し、目的物 1.17 g (m. p. 127-128°C, 41%) を得た。更に副生成物として5-アミノ-4-クロロ-6-(N-メチル-4-フルオロ-3-トリフルオロメチルアニリノ)ピリミジン 0.07 g (アモルファス 3.7%) を得た。この化合物のNMRを次に示す。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 300 MHz)

$\delta$  3.48 (s, 3H), 3.60 (br. s, 2H,  $-\text{NH}_2$ ), 7.03~7.27 (m, 3H, ArH), 8.25 (s, 1H) (ppm)

(実施例 5)

5-ジメチルアミノ-4,6-ビス(4-フルオロ-3-トリフルオロメチルフェノキシ)ピリミジン(化合物番号6) :

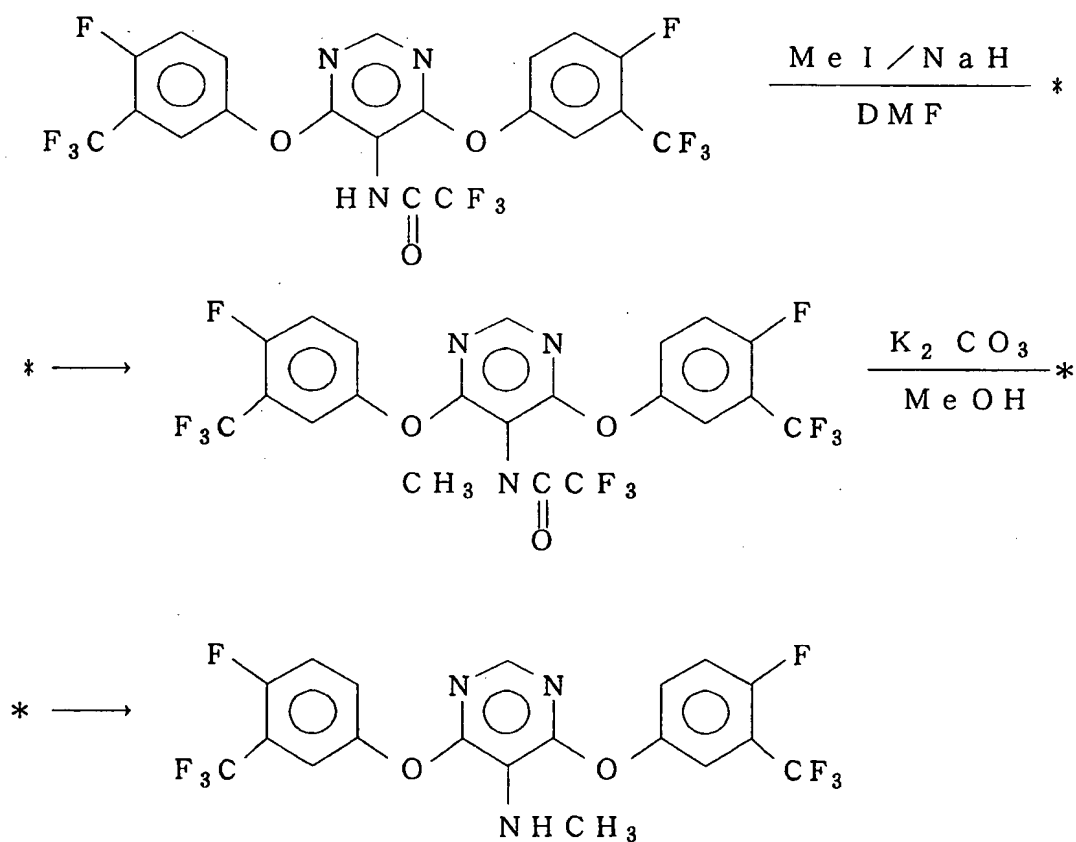


5-アミノ-4,6-ビス(4-フルオロ-3-トリフルオロメチルフェノキシ)

シ) ピリミジン 0.40 g (0.886 mmol) の DMF (4 mL) 溶液に室温で水素化ナトリウム 0.05 g (60% : 1.25 mmol) を加え、15 分間攪拌した後、ヨウ化メチル 0.25 g (1.76 mmol) を滴下しながら加えた。反応混合物を室温でさらに 30 分間攪拌した後、水素化ナトリウム 0.05 g を加え、15 分間攪拌し、そこへヨウ化メチル 0.25 g を滴下し、そのまま室温で一晩攪拌した。反応混合物を水中に注ぎ入れ、エーテルにより抽出し、有機層を無水硫酸マグネシウムにより乾燥させた。その後、濾過、減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにより精製し、目的物 0.16 g (アモルファス、39%) を得た。

(実施例 6)

4, 6-ビス(4-フルオロ-3-トリフルオロメチルフェノキシ)-5-メチルアミノ-ピリミジン(化合物番号 2) :



4, 6-ビス(4-フルオロ-3-トリフルオロメチルフェノキシ)-5-

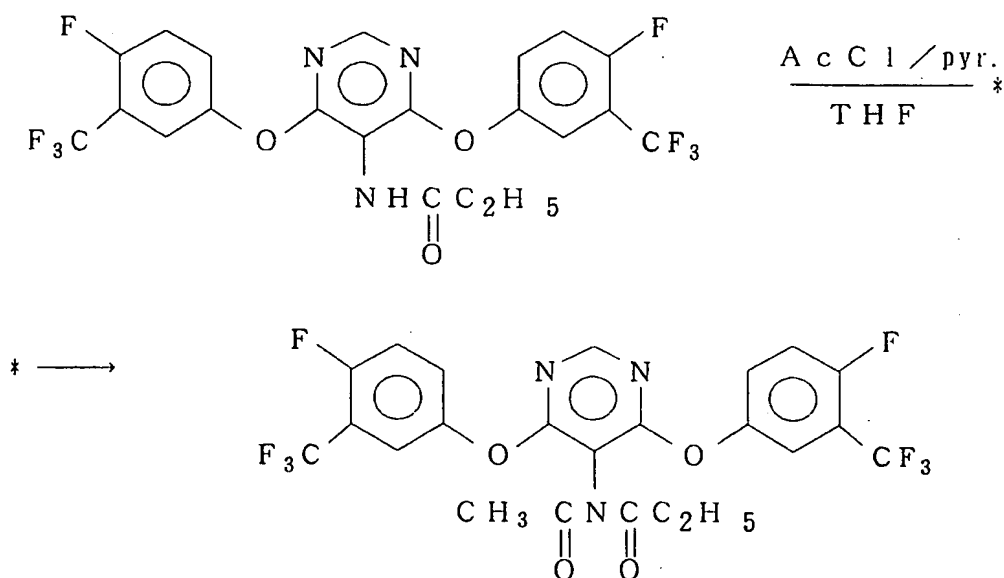
トリフルオロアセチルアミノ)ピリミジン 1.03 g (1.88 mmol) の DMF (10 mL) 溶液を 0℃ に冷却し、水素化ナトリウム 0.10 g (60% : 2.5 mmol) を加えた後、室温で 30 分間攪拌した。そこへ、ヨウ化メチル 0.40 g (2.82 mmol) を滴下しながら加え、さらに一晩、室温で反応させた。反応混合物を水中に注ぎ、エーテル抽出した。有機層を無水硫酸マグネシウムにより乾燥し濾過後、減圧濃縮した。

得られた化合物 (化合物番号 30) を主成分とする残渣をメタノールに溶解させ、炭酸カリウム 0.30 g (2.17 mmol) を加え、室温で一晩攪拌した。溶媒として用いたメタノールを減圧下留去し、水中に注ぎ入れエーテル抽出した。有機層を無水硫酸マグネシウムにより乾燥させ、濾過後、減圧濃縮した。

残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにより精製し、目的物 0.28 g (32%) を得た。m. p. 66 – 68℃

(実施例 7)

4, 6-ビス (4-フルオロ-3-トリフルオロメチルフェノキシ) - 5 - (アセチルプロピオニルアミノ) ピリミジン (化合物番号 40) :



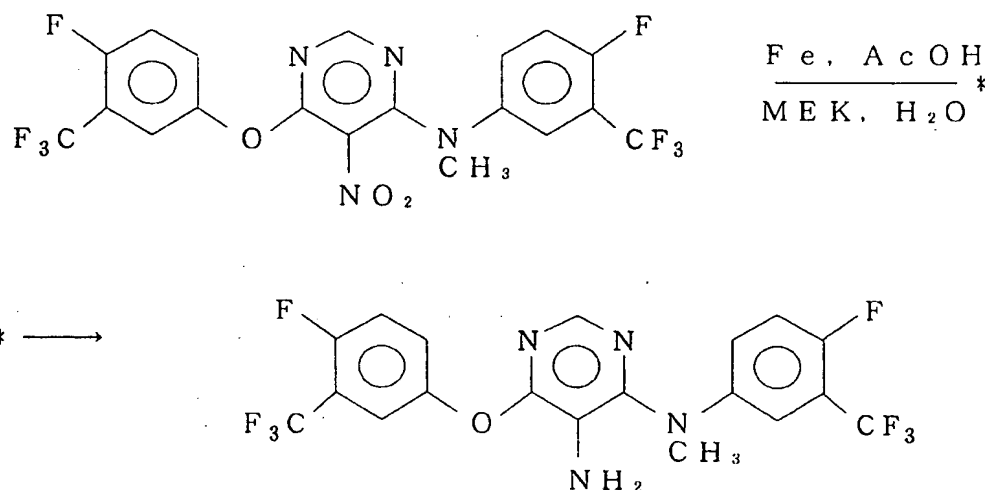
4, 6-ビス (4-フルオロ-3-トリフルオロメチルフェノキシ) - 5-プロピオニルアミノ-ピリミジン 0.40 g (0.79 mmol) の THF (6 mL)

L) 溶液に、ピリジン 0.62 g (7.8 mmol) および塩化アセチル 0.12 g (1.5 mmol) を室温で攪拌しながら加えた。この混合物を徐々に加熱し還流下一晩反応させた。その後、反応液を室温まで冷却し水に注ぎ入れ、ジエチルエーテルで2度抽出した。有機層を無水硫酸マグネシウムにより乾燥し濾過後、減圧濃縮した。

残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにより精製し、目的物 0.32 g (収率 74%) を得た。m. p. 75–76.5 °C

(実施例 8)

5-アミノ-4-(4'-フルオロ-3'-トリフルオロメチルフェノキシ)-b-(N-メチル-4'-フルオロ-3'-トリフルオロメチルアニリノ)ピリミジン (化合物番号 682)

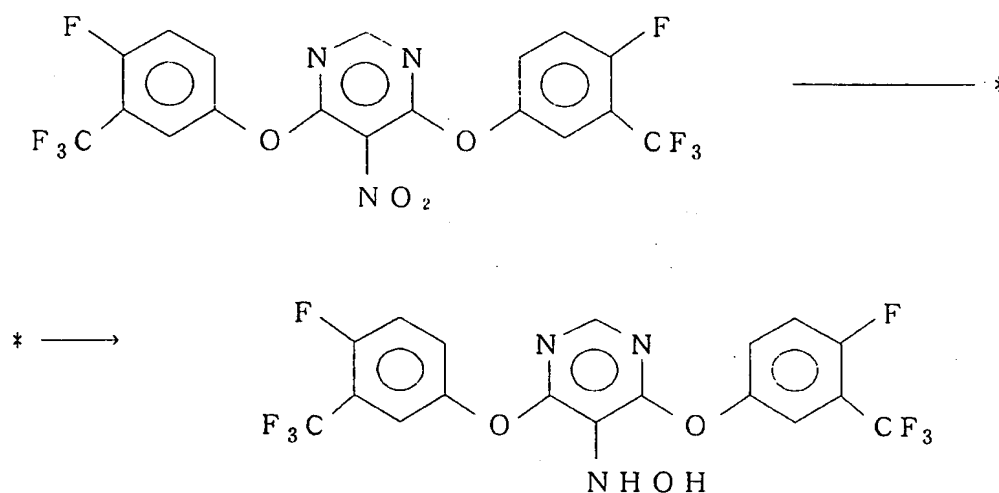


4-(4'-フルオロ-3'-トリフルオロメチルフェノキシ)-b-(N-メチル-4'-フルオロ-3'-トリフルオロメチルアニリノ)-5-ニトロピリミジン 2.15 g (4.35 mmol) のメチルエチルケトン 50 ml 溶液に水 25 ml および酢酸 25 ml を加え、室温で攪拌しながら、更に電解鉄 2.19 g (39.2 mmol) を加え、50–60 °C で3時間反応させた。その後、反応混合物を0 °C に冷却し、少しずつ炭酸水素ナトリウム粉末を加え中和したのち、セライトでろ過した。ろ液に水および酢酸エチルを加え、有機層を分離し、

水層をエーテルで抽出した。全ての有機層を合わせ、無水硫酸マグネシウムで乾燥させろ過し、ろ液を減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにより精製し、目的物 1.71 g (収率 85% アモルファス) を得た。

(実施例 9)

4, 6-ビス(4'-フルオロ-3'-トリフルオロメチルフェノキシ)-5-ヒドロキシルアミノピリミジン(化合物番号 82)

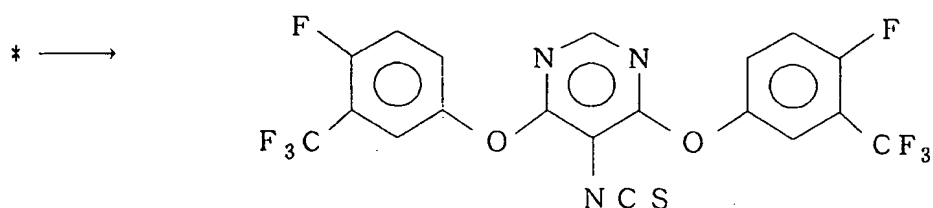
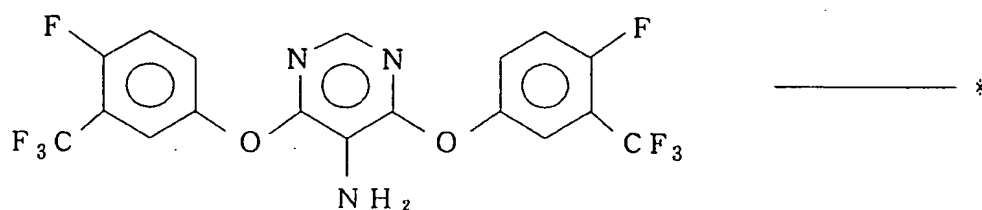


4, 6-ビス(4'-フルオロ-3'-トリフルオロメチルフェノキシ)-5-ニトロピリミジン 28.43 g (48.1 mmol)、水 8 ml、THF 12 ml および次亜リン酸ナトリウム一水和物 15.7 g (144.4 mmol) の混合液に、5%パラジウム/炭素 3.8 g (1.78 mmol) を加え、室温で 1 時間攪拌した。不溶物をセライトでろ過したのち、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥させろ過し、ろ液を減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにより精製し、結晶を n-ヘキサンで洗浄し、目的物 2.86 g (収率 13%) を得た。m. p. 100-103°C

(実施例 10)

5-イソチオシアナト-4, 6-ビス(4'-フルオロ-3'-トリフルオロ

メチルフェノキシ)ピリミジン(化合物番号71)

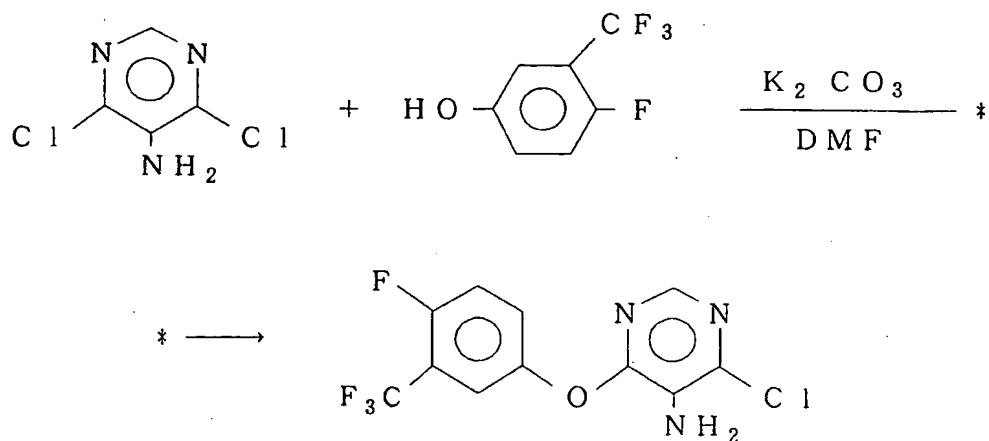


チオホスゲン 0.42 g (3.65 mmol) のクロロホルム (25 ml) 溶液に室温で炭酸水素ナトリウム 0.57 g (6.78 mmol) の水溶液 50 ml を加え攪拌した。この混合物 0℃ に冷却し、攪拌しながら、5-アミノ-4,6-ビス(4'-フルオロ-3'-トリフルオロメチルフェノキシ)ピリミジン 1.51 g (3.35 mmol) のクロロホルム 25 ml 溶液を徐々に加えた。

その後、反応混合物をゆっくりと室温まで昇温し、35-45℃ で3時間、還流下で8時間反応させた。反応混合物を室温まで冷却し、有機層を分離し、水層をクロロホルムで抽出した。全ての有機層を合わせ、無水硫酸マグネシウムで乾燥させる過し、ろ液を減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにより精製し、目的物 0.25 g (収率 15%) を得た。m. p. 99.5-101℃

(参考例1)

5-アミノ-4-クロロ-6-(4-フルオロ-3-トリフルオロメチルフェノキシ)ピリミジン:



5-アミノ-4,6-ジクロロピリミジン 2.00 g (11.8 mmol) および 4-フルオロ-3-トリフルオロメチルフェノール 2.63 g (14.2 mmol) の DMF (25 mL) 溶液を 0℃ に冷却し、炭酸カリウム 4.89 g (35.4 mmol) を少しずつ加えた。反応混合物を徐々に昇温し、室温で一晩、40℃ で 8 時間攪拌した。

その後、反応混合物を水中に注ぎ入れ、エーテルにより抽出した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、濾過し、減圧濃縮した。

得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにより精製し、目的物 2.00 g (55%) m. p. 82-86℃ を得た。

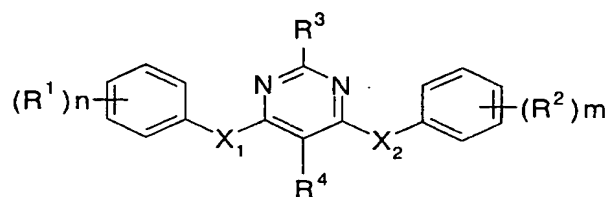
上記実施例を含み、同様に製造することの出来る本発明化合物の例を第 1 表にまとめて示す。

なお、表中の略号はそれぞれ次の意味を示す。

Me : メチル Et : エチル Pr : プロピル Bu : ブチル

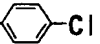
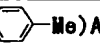
Ac : アセチル Ph : フェニル n : ノルマル i : イソ t : ターシャリー

第 1 表



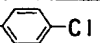
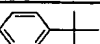
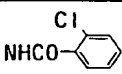


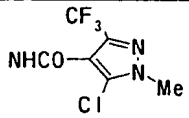
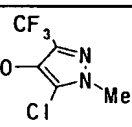
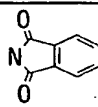



| No. | (R¹) <sub>n</sub> | (R²) <sub>m</sub> | R³ | R⁴  | X₁ | X₂ | 物性値(融点)                      |
|-----|-------------------|-------------------|----|---|----|----|------------------------------|
| 1   | 3-CF₃,4-F         | 3-CF₃,4-F         | H  | NH₂   | O  | O  | 75-79°C                      |
| 2   | 3-CF₃,4-F         | 3-CF₃,4-F         | H  | NHMe  | O  | O  | 66-68°C                      |
| 3   | 3-CF₃,4-F         | 3-CF₃,4-F         | H  | NHEt  | O  | O  |                              |
| 4   | 3-CF₃,4-F         | 3-CF₃,4-F         | H  | NH <sup>n</sup> Pr  | O  | O  |                              |
| 5   | 3-CF₃,4-F         | 3-CF₃,4-F         | H  | NH <sup>i</sup> Pr  | O  | O  |                              |
| 6   | 3-CF₃,4-F         | 3-CF₃,4-F         | H  | NMe₂  | O  | O  | アモルファス <sup>1</sup> H-NMR(a) |
| 7   | 3-CF₃,4-F         | 3-CF₃,4-F         | H  | NEt₂  | O  | O  |                              |
| 8   | 3-CF₃,4-F         | 3-CF₃,4-F         | H  | N( <sup>i</sup> Pr)₂  | O  | O  |                              |
| 9   | 3-CF₃,4-F         | 3-CF₃,4-F         | H  | NHCHO   | O  | O  |                              |
| 10  | 3-CF₃,4-F         | 3-CF₃,4-F         | H  | NHAc  | O  | O  | 123-125°C                    |
| 11  | 3-CF₃,4-F         | 3-CF₃,4-F         | H  | NHCOEt  | O  | O  | 142-143.5°C                  |
| 12  | 3-CF₃,4-F         | 3-CF₃,4-F         | H  | NHCO <sup>n</sup> Pr  | O  | O  |                              |
| 13  | 3-CF₃,4-F         | 3-CF₃,4-F         | H  | NHCO <sup>i</sup> Pr  | O  | O  |                              |
| 14  | 3-CF₃,4-F         | 3-CF₃,4-F         | H  | NHCO <sup>n</sup> Bu  | O  | O  |                              |
| 15  | 3-CF₃,4-F         | 3-CF₃,4-F         | H  | NHCO <sup>i</sup> Bu  | O  | O  |                              |
| 16  | 3-CF₃,4-F         | 3-CF₃,4-F         | H  | NHCOCF₃   | O  | O  | 121-122°C                    |
| 17  | 3-CF₃,4-F         | 3-CF₃,4-F         | H  | NHCOCF₂CF₃  | O  | O  | 111-113°C                    |
| 18  | 3-CF₃,4-F         | 3-CF₃,4-F         | H  | NHCOOMe   | O  | O  |                              |
| 19  | 3-CF₃,4-F         | 3-CF₃,4-F         | H  | NHSOMe  | O  | O  |                              |
| 20  | 3-CF₃,4-F         | 3-CF₃,4-F         | H  | NHSO₂Me   | O  | O  |                              |
| 21  | 3-CF₃,4-F         | 3-CF₃,4-F         | H  | NHSO₂CF₃  | O  | O  |                              |
| 22  | 3-CF₃,4-F         | 3-CF₃,4-F         | H  | NHSO₂-  Me | O  | O  |                              |
| 23  | 3-CF₃,4-F         | 3-CF₃,4-F         | H  | NHCOPh  | O  | O  |                              |



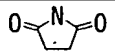
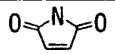








| No. | (R <sup>1</sup> ) <sub>n</sub> | (R <sup>2</sup> ) <sub>m</sub> | R <sup>3</sup> | R <sup>4</sup>   | X <sub>1</sub> | X <sub>2</sub> | 物性値                   |
|-----|--------------------------------|--------------------------------|----------------|--|----------------|----------------|-----------------------|
| 24  | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              | NHCO-  -Cl                    | O              | O              |                       |
| 25  | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              | N(Me)CHO   | O              | O              |                       |
| 26  | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              | N(Me)Ac  | O              | O              |                       |
| 27  | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              | N(Et)Ac  | O              | O              |                       |
| 28  | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              | N(Me)COEt  | O              | O              | 170-171°C             |
| 29  | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              | N(Me)CO <sup>i</sup> Pr  | O              | O              |                       |
| 30  | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              | N(Me)COCF <sub>3</sub>   | O              | O              | <sup>1</sup> H-NMR(b) |
| 31  | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              | N(Ac) <sub>2</sub>   | O              | O              | 138-139°C             |
| 32  | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              | N(COCF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>   | O              | O              |                       |
| 33  | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              | N(COEt) <sub>2</sub>   | O              | O              | 98-100°C              |
| 34  | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              | N(CO <sup>n</sup> Pr) <sub>2</sub>   | O              | O              |                       |
| 35  | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              | N(CO <sup>i</sup> Pr) <sub>2</sub>   | O              | O              |                       |
| 36  | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              | N(CO <sup>n</sup> Bu) <sub>2</sub>   | O              | O              |                       |
| 37  | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              | N(COPh) <sub>2</sub>   | O              | O              |                       |
| 38  | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              | N(COMe)CHO   | O              | O              |                       |
| 39  | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              | N(COEt)CHO   | O              | O              |                       |
| 40  | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              | N(COEt)Ac  | O              | O              | 75-76.5°C             |
| 41  | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              | N(CO <sup>n</sup> Pr)Ac  | O              | O              |                       |
| 42  | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              | N(CO <sup>i</sup> Pr)Ac  | O              | O              | 100-101°C             |
| 43  | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              | N(CO <sup>n</sup> Bu)Ac  | O              | O              |                       |
| 44  | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              | N(COPh)Ac  | O              | O              |                       |
| 45  | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              | N(SO <sub>2</sub> Me)Ac  | O              | O              |                       |
| 46  | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              | N(SO <sub>2</sub> -  -Me)Ac | O              | O              |                       |
| 47  | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              | N(COOEt)Ac   | O              | O              |                       |
| 48  | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              | N(COCF <sub>3</sub> )Ac  | O              | O              |                       |
| 49  | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              | N(COEt)COCF <sub>3</sub>   | O              | O              |                       |
| 50  | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              | N(CO <sup>n</sup> Pr)COCF <sub>3</sub>   | O              | O              |                       |
| 51  | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              | N(CO <sup>n</sup> Pr)COEt  | O              | O              | アモルファス                |

| No. | (R <sup>1</sup> ) <sub>n</sub> | (R <sup>2</sup> ) <sub>m</sub> | R <sup>3</sup> | R <sup>4</sup>   | X <sub>1</sub> | X <sub>2</sub> | 物性値 (融点)                     |
|-----|--------------------------------|--------------------------------|----------------|--|----------------|----------------|------------------------------|
| 52  | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              | N(CO <sup>i</sup> Pr)COEt  | O              | O              | 101-102°C                    |
| 53  | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              | N(CO <sup>n</sup> Bu)COEt  | O              | O              |                              |
| 54  | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              | N(CO <sup>i</sup> Pr)CO <sup>n</sup> Pr  | O              | O              |                              |
| 55  | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              | N(CO <sup>n</sup> Bu)CO <sup>n</sup> Pr  | O              | O              |                              |
| 56  | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              | NHCH <sub>2</sub> Ac   | O              | O              |                              |
| 57  | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              | N(CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl) <sub>2</sub>                                   | O              | O              |                              |
| 58  | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              | NH  | O              | O              |                              |
| 59  | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              | NHCONHMe   | O              | O              |                              |
| 60  | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              | NHCONMe <sub>2</sub>   | O              | O              |                              |
| 61  | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              | NHCONHEt   | O              | O              |                              |
| 62  | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              | NHCONHPh   | O              | O              |                              |
| 63  | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              | NHCOCH <sub>2</sub> OMe  | O              | O              | 126-129°C                    |
| 64  | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              | NHCOCO <sub>2</sub> Me   | O              | O              | 125-128°C                    |
| 65  | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              | N(COEt)CO <sub>2</sub> Et  | O              | O              | 111-112°C                    |
| 66  | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              | NHCO(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> Cl   | O              | O              | 146-149°C                    |
| 67  | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              | N(COEt)COCH <sub>2</sub> OMe   | O              | O              | 98-100°C                     |
| 68  | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              | N(COEt)CO(CH <sub>2</sub> ) <sub>8</sub> Me  | O              | O              | アモルファス <sup>1</sup> H-NMR(c) |
| 69  | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              | NHCOCH(Cl)Me   | O              | O              | 114-117°C                    |
| 70  | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              | N(COEt)CH <sub>2</sub> OAc   | O              | O              | 131-132°C                    |
| 71  | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              | NCS  | O              | O              | 99.5-101°C                   |
| 72  | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              | N(COEt)COCO <sub>2</sub> Me  | O              | O              | 155-158°C                    |
| 73  | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              | N(SO <sub>2</sub> Me) <sub>2</sub>   | O              | O              | 95-98°C                      |
| 74  | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              | N(COEt)COCH(Cl)Me  | O              | O              | 94-96°C                      |
| 75  | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              | N(COEt)COCH <sub>2</sub> OH  | O              | O              | 134-138°C                    |
| 76  | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              | N(COEt)(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> CO <sub>2</sub> Et                            | O              | O              | 116-118°C                    |
| 77  | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              | N(COCH <sub>2</sub> OMe) <sub>2</sub>  | O              | O              | 130-132°C                    |
| 78  | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              | N(COEt)CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> H   | O              | O              | アモルファス <sup>1</sup> H-NMR(d) |
| 79  | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              | NHCOCF <sub>2</sub> Cl   | O              | O              | 140-141°C                    |

| No. | (R <sup>1</sup> ) <sub>n</sub> | (R <sup>2</sup> ) <sub>m</sub> | R <sup>3</sup> | R <sup>4</sup>  | X <sub>1</sub> | X <sub>2</sub> | 物性値 (融点)                              |
|-----|--------------------------------|--------------------------------|----------------|---|----------------|----------------|---------------------------------------|
| 80  | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              | N(COEt)CH <sub>2</sub> C≡CH                               | O              | O              | 129-130.5°C                           |
| 81  | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              | N(COCH <sub>2</sub> OMe)COCH(Br)Me                        | O              | O              | 136-139°C                             |
| 82  | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              | NHOH  | O              | O              | 100-103°C                             |
| 83  | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              | N(COCH <sub>2</sub> OMe)CH(Cl)Me                          | O              | O              | 132-135°C                             |
| 84  | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              | N(Ac)COCH <sub>2</sub> OMe                                | O              | O              | n <sub>D</sub> <sup>19.4</sup> 1.5014 |
| 85  | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              | N(COCH <sub>2</sub> OMe)COCH <sub>2</sub> OAc             | O              | O              | 104-107°C                             |
| 86  | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              | N(Et)COEt   | O              | O              | 151-152°C                             |
| 87  | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              | N(COCH <sub>2</sub> OMe)COCH <sub>2</sub> Cl              | O              | O              | 120-121°C                             |
| 88  | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              | N(Me)COCH <sub>2</sub> OMe                                | O              | O              | 145-147°C                             |
| 89  | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              | N(COEt)COCH <sub>2</sub> OEt                              | O              | O              | 117-120°C                             |
| 90  | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              | N(COCH <sub>2</sub> OMe)CH <sub>2</sub> CN                | O              | O              | 133-135°C                             |
| 91  | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              | N(COCH <sub>2</sub> OMe)CH <sub>2</sub> OMe               | O              | O              | n <sub>D</sub> <sup>20.5</sup> 1.4936 |
| 92  | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              | N(COCH <sub>2</sub> OMe)CH <sub>2</sub> OAc               | O              | O              | 134-137°C                             |
| 93  | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              | N(COEt)CH <sub>2</sub> CN                                 | O              | O              | 138-142°C                             |
| 94  | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              | N(COCH <sub>2</sub> OAc) <sub>2</sub>                     | O              | O              | 149-152°C                             |
| 95  | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              | NHCOCH <sub>2</sub> OEt                                   | O              | O              | 102-104°C                             |
| 96  | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              | N(COEt)COCH <sub>2</sub> OAc                              | O              | O              | 129-131°C                             |
| 97  | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              | N(COEt)CO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> | O              | O              | 76.5-78.5°C                           |
| 98  | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              | N(COEt)COC(Me) <sub>2</sub> OAc                           | O              | O              | 93-95°C                               |
| 99  | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              | N(COEt)CONMe <sub>2</sub>                                 | O              | O              | 148-150°C                             |
| 100 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              | N(COEt)CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> Et                 | O              | O              | 145-147°C                             |
| 101 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              | N(Me)OH   | O              | O              | viscous oil<br><sup>1</sup> H-NMR(e)  |
| 102 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              | N(COEt)CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>                 | O              | O              | 105-107°C                             |
| 103 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              | NHOMe   | O              | O              |                                       |
| 104 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              | NHOAc   | O              | O              |                                       |
| 105 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              | NMe(OMe)  | O              | O              |                                       |
| 106 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              | N(Ac)OAc  | O              | O              |                                       |
| 107 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              | N(Me)OAc  | O              | O              |                                       |

| No. | (R <sup>1</sup> ) <sub>n</sub> | (R <sup>2</sup> ) <sub>m</sub> | R <sup>3</sup> | R <sup>4</sup>  | X <sub>1</sub> | X <sub>2</sub> | 物性値 (融点)  |
|-----|--------------------------------|--------------------------------|----------------|---|----------------|----------------|-----------|
| 108 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              | N(Me)OCOCF <sub>3</sub>   | O              | O              |           |
| 109 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              | N(Me)OCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>  | O              | O              |           |
| 110 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              | N(Me)OCH <sub>2</sub> C≡CH  | O              | O              |           |
| 111 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              | N=CHMe  | O              | O              |           |
| 112 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              | N=CMe <sub>2</sub>  | O              | O              |           |
| 113 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              | N=CH <sup>n</sup> Et  | O              | O              |           |
| 114 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              | N=CH <sup>n</sup> Pr  | O              | O              |           |
| 115 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              | N=CHPh  | O              | O              |           |
| 116 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              | N=CH-  -Cl                               | O              | O              |           |
| 117 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              | N=CH-  -C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> | O              | O              |           |
| 118 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              | N=CHNMe <sub>2</sub>  | O              | O              | 194-195   |
| 119 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              | N=C(Me)NH <sub>2</sub>  | O              | O              |           |
| 120 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              | N=C(SMe) <sub>2</sub>   | O              | O              |           |
| 121 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              |                                        | O              | O              | 159-160°C |
| 122 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              | N(COEt)CO-  -Cl                        | O              | O              | 139-140°C |
| 123 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              | N(COEt)CO-  -Cl                        | O              | O              | 42-45°C   |
| 124 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              |                                        | O              | O              | 162-164°C |
| 125 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              | N(COEt)CO-                            | O              | O              | 52-54°C   |
| 126 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              |                                        | O              | O              |           |
| 127 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              |                                        | O              | O              |           |
| 128 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              |                                        | O              | O              |           |
| 129 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              |                                        | O              | O              |           |

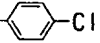
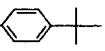
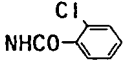


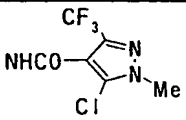
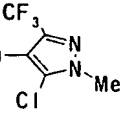
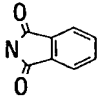
| No. | (R <sup>1</sup> ) <sub>n</sub> | (R <sup>2</sup> ) <sub>m</sub> | R <sup>3</sup> | R <sup>4</sup>  | X <sub>1</sub> | X <sub>2</sub> | 物性値 (融点)  |
|-----|--------------------------------|--------------------------------|----------------|---|----------------|----------------|-----------|
| 130 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              |              | O              | O              |           |
| 131 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              |              | O              | O              |           |
| 132 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              |              | O              | O              | 154-156°C |
| 133 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              |              | O              | O              |           |
| 134 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              |              | O              | O              |           |
| 135 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              |              | O              | O              | 162-164°C |
| 136 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              | N(COEt)CO-N  | O              | O              | 150-151°C |
| 137 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | NH <sub>2</sub>   | O              | O              | 124-125°C |
| 138 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | NHMe  | O              | O              |           |
| 139 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | NHEt  | O              | O              |           |
| 140 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | NH <sup>n</sup> Pr  | O              | O              |           |
| 141 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | NH <sup>i</sup> Pr  | O              | O              |           |
| 142 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | NMe <sub>2</sub>  | O              | O              |           |
| 143 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | NEt <sub>2</sub>  | O              | O              |           |
| 144 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N <sup>i</sup> (Pr) <sub>2</sub>  | O              | O              |           |
| 145 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | NHCHO   | O              | O              |           |
| 146 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | NHAc  | O              | O              | 141-142°C |
| 147 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | NHCOEt  | O              | O              | 162-163°C |
| 148 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | NHCO <sup>n</sup> Pr  | O              | O              |           |
| 149 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | NHCO <sup>i</sup> Pr  | O              | O              |           |
| 150 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | NHCO <sup>n</sup> Bu  | O              | O              |           |
| 151 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | NHCO <sup>i</sup> Bu  | O              | O              |           |
| 152 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | NHCOCF <sub>3</sub>   | O              | O              | 136-137°C |
| 153 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | NHCOCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>   | O              | O              |           |
| 154 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | NHCOOMe   | O              | O              |           |
| 155 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | NHSO <sub>2</sub> Me  | O              | O              |           |








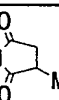


| No. | (R <sup>1</sup> ) <sub>n</sub> | (R <sup>2</sup> ) <sub>m</sub> | R <sup>3</sup> | R <sup>4</sup>   | X <sub>1</sub> | X <sub>2</sub> | 物性値 (融点)  |
|-----|--------------------------------|--------------------------------|----------------|--|----------------|----------------|-----------|
| 156 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | NHSO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>  | O              | O              |           |
| 157 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | NHSO <sub>2</sub> -  -Me      | O              | O              |           |
| 158 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | NHCOPh   | O              | O              |           |
| 159 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | NHCO-  -Cl                    | O              | O              |           |
| 160 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(Me)CHO   | O              | O              |           |
| 161 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(Me)Ac  | O              | O              |           |
| 162 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(Et)Ac  | O              | O              |           |
| 163 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(Me)COEt  | O              | O              |           |
| 164 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(Me)CO <sup>i</sup> Pr  | O              | O              |           |
| 165 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(Me)COCF <sub>3</sub>   | O              | O              |           |
| 166 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(Ac) <sub>2</sub>   | O              | O              | 107-108°C |
| 167 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(COCF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>   | O              | O              |           |
| 168 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(COEt) <sub>2</sub>   | O              | O              |           |
| 169 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(CO <sup>n</sup> Pr) <sub>2</sub>   | O              | O              |           |
| 170 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(CO <sup>i</sup> Pr) <sub>2</sub>   | O              | O              |           |
| 171 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(CO <sup>n</sup> Bu) <sub>2</sub>   | O              | O              |           |
| 172 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(COPh) <sub>2</sub>   | O              | O              |           |
| 173 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(COMe)CHO   | O              | O              |           |
| 174 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(COEt)CHO   | O              | O              |           |
| 175 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(COEt)Ac  | O              | O              | 96-98°C   |
| 176 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(CO <sup>n</sup> Pr)Ac  | O              | O              |           |
| 177 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(CO <sup>i</sup> Pr)Ac  | O              | O              |           |
| 178 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(CO <sup>n</sup> Bu)Ac  | O              | O              |           |
| 179 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(COPh)Ac  | O              | O              |           |
| 180 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(SO <sub>2</sub> Me)Ac  | O              | O              |           |
| 181 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(SO <sub>2</sub> -  -Me)Ac | O              | O              |           |
| 182 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(COOEt)Ac   | O              | O              |           |
| 183 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(COCF <sub>3</sub> )Ac  | O              | O              |           |

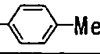
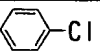
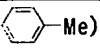
| No. | (R <sup>1</sup> ) <sub>n</sub> | (R <sup>2</sup> ) <sub>m</sub> | R <sup>3</sup> | R <sup>4</sup>   | X <sub>1</sub> | X <sub>2</sub> | 物性値 (融点) |
|-----|--------------------------------|--------------------------------|----------------|--|----------------|----------------|----------|
| 184 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(COEt)COCF <sub>3</sub>   | O              | O              |          |
| 185 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(CO <sup>n</sup> Pr)COCF <sub>3</sub>   | O              | O              |          |
| 186 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(CO <sup>n</sup> Pr)COEt  | O              | O              |          |
| 187 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(CO <sup>i</sup> Pr)COEt  | O              | O              |          |
| 188 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(CO <sup>n</sup> Bu)COEt  | O              | O              |          |
| 189 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(CO <sup>i</sup> Pr)CO <sup>n</sup> Pr  | O              | O              |          |
| 190 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(CO <sup>n</sup> Bu)CO <sup>n</sup> Pr  | O              | O              |          |
| 191 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | NHCH <sub>2</sub> Ac   | O              | O              |          |
| 192 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl) <sub>2</sub>                                   | O              | O              |          |
| 193 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | NH  | O              | O              |          |
| 194 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | NHCONHMe   | O              | O              |          |
| 195 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | NHCONMe <sub>2</sub>   | O              | O              |          |
| 196 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | NHCONHEt   | O              | O              |          |
| 197 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | NHCONHPh   | O              | O              |          |
| 198 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | NHCOCH <sub>2</sub> OMe  | O              | O              |          |
| 199 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | NHCOCO <sub>2</sub> Me   | O              | O              |          |
| 200 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(COEt)CO <sub>2</sub> Et  | O              | O              |          |
| 201 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | NHCO(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> Cl   | O              | O              |          |
| 202 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(COEt)COCH <sub>2</sub> OMe   | O              | O              |          |
| 203 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(COEt)CO(CH <sub>2</sub> ) <sub>8</sub> Me  | O              | O              |          |
| 204 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | NHCOCH(Cl)Me   | O              | O              |          |
| 205 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(COEt)CH <sub>2</sub> OAc   | O              | O              |          |
| 206 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | NCS  | O              | O              |          |
| 207 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(COEt)COCO <sub>2</sub> Me  | O              | O              |          |
| 208 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(SO <sub>2</sub> Me) <sub>2</sub>   | O              | O              |          |
| 209 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(COEt)COCH(Cl)Me  | O              | O              |          |
| 210 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(COEt)COCH <sub>2</sub> OH  | O              | O              |          |
| 211 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(COEt)(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> CO <sub>2</sub> Et                            | O              | O              |          |


| No. | (R <sup>1</sup> ) <sub>n</sub> | (R <sup>2</sup> ) <sub>m</sub> | R <sup>3</sup> | R <sup>4</sup>  | X <sub>1</sub> | X <sub>2</sub> | 物性値 (融点) |
|-----|--------------------------------|--------------------------------|----------------|---|----------------|----------------|----------|
| 212 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(COCH <sub>2</sub> OMe) <sub>2</sub>                     | O              | O              |          |
| 213 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(COEt)CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> H                  | O              | O              |          |
| 214 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | NHCOCF <sub>2</sub> Cl                                    | O              | O              |          |
| 215 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(COEt)CH <sub>2</sub> C≡CH                               | O              | O              |          |
| 216 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(COCH <sub>2</sub> OMe)COCH(Br)Me                        | O              | O              |          |
| 217 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | NHOH  | O              | O              |          |
| 218 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(COCH <sub>2</sub> OMe)CH(Cl)Me                          | O              | O              |          |
| 219 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(Ac)COCH <sub>2</sub> OMe                                | O              | O              |          |
| 220 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(COCH <sub>2</sub> OMe)COCH <sub>2</sub> OAc             | O              | O              |          |
| 221 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(Et)COEt   | O              | O              |          |
| 222 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(COCH <sub>2</sub> OMe)COCH <sub>2</sub> Cl              | O              | O              |          |
| 223 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(Me)COCH <sub>2</sub> OMe                                | O              | O              |          |
| 224 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(COEt)COCH <sub>2</sub> OEt                              | O              | O              |          |
| 225 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(COCH <sub>2</sub> OMe)CH <sub>2</sub> CN                | O              | O              |          |
| 226 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(COCH <sub>2</sub> OMe)CH <sub>2</sub> OMe               | O              | O              |          |
| 227 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(COCH <sub>2</sub> OMe)CH <sub>2</sub> OAc               | O              | O              |          |
| 228 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(COEt)CH <sub>2</sub> CN                                 | O              | O              |          |
| 229 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(COCH <sub>2</sub> OAc) <sub>2</sub>                     | O              | O              |          |
| 230 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | NHCOCH <sub>2</sub> OEt                                   | O              | O              |          |
| 231 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(COEt)COCH <sub>2</sub> OAc                              | O              | O              |          |
| 232 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(COEt)CO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> | O              | O              |          |
| 233 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(COEt)COC(Me) <sub>2</sub> OAc                           | O              | O              |          |
| 234 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(COEt)CONMe <sub>2</sub>                                 | O              | O              |          |
| 235 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(COEt)CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> Et                 | O              | O              |          |
| 236 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(Me)OH   | O              | O              |          |
| 237 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(COEt)CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>                 | O              | O              |          |
| 238 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | NHOMe   | O              | O              |          |
| 239 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | NHOAc   | O              | O              |          |









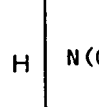
| No. | (R <sup>1</sup> ) <sub>n</sub> | (R <sup>2</sup> ) <sub>m</sub> | R <sup>3</sup> | R <sup>4</sup>  | X <sub>1</sub> | X <sub>2</sub> | 物性値 (融点) |
|-----|--------------------------------|--------------------------------|----------------|---|----------------|----------------|----------|
| 240 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | NMe(OMe)  | O              | O              |          |
| 241 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(Ac)OAc  | O              | O              |          |
| 242 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(Me)OAc  | O              | O              |          |
| 243 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(Me)OCOCF <sub>3</sub>   | O              | O              |          |
| 244 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(Me)OCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>  | O              | O              |          |
| 245 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(Me)OCH <sub>2</sub> C≡CH  | O              | O              |          |
| 246 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N=CHMe  | O              | O              |          |
| 247 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N=CMe <sub>2</sub>  | O              | O              |          |
| 248 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N=CHEt  | O              | O              |          |
| 249 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N=CH <sup>n</sup> Pr  | O              | O              |          |
| 250 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N=CHPh  | O              | O              |          |
| 251 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N=CH-          | O              | O              |          |
| 252 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N=CH-         | O              | O              |          |
| 253 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N=CHNMe <sub>2</sub>  | O              | O              |          |
| 254 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N=C(Me)NH <sub>2</sub>  | O              | O              |          |
| 255 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N=C(SMe) <sub>2</sub>   | O              | O              |          |
| 256 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              |              | O              | O              |          |
| 257 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(COEt)CO-   | O              | O              |          |
| 258 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(COEt)CO-   | O              | O              |          |
| 259 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              |              | O              | O              |          |
| 260 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(COEt)CO-  | O              | O              |          |
| 261 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              |              | O              | O              |          |

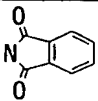







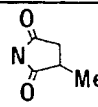


| No. | (R <sup>1</sup> ) <sub>n</sub> | (R <sup>2</sup> ) <sub>m</sub> | R <sup>3</sup> | R <sup>4</sup>  | X <sub>1</sub> | X <sub>2</sub> | 物性値 (融点)                     |
|-----|--------------------------------|--------------------------------|----------------|---|----------------|----------------|------------------------------|
| 262 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              |              | O              | O              |                              |
| 263 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              |              | O              | O              |                              |
| 264 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              |              | O              | O              |                              |
| 265 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              |              | O              | O              |                              |
| 266 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              |              | O              | O              |                              |
| 267 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              |              | O              | O              |                              |
| 268 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              |              | O              | O              |                              |
| 269 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              |              | O              | O              |                              |
| 270 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              |              | O              | O              |                              |
| 271 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(COEt)CO-N  | O              | O              |                              |
| 272 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | NH <sub>2</sub>   | O              | O              | アモルファス <sup>1</sup> H-NMR(f) |
| 273 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | NHMe  | O              | O              |                              |
| 274 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | NHEt  | O              | O              |                              |
| 275 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | NH <sup>n</sup> Pr  | O              | O              |                              |
| 276 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | NH <sup>i</sup> Pr  | O              | O              |                              |
| 277 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | NMe <sub>2</sub>  | O              | O              |                              |
| 278 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | NEt <sub>2</sub>  | O              | O              |                              |
| 279 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N( <sup>i</sup> Pr) <sub>2</sub>  | O              | O              |                              |
| 280 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | NHCHO   | O              | O              |                              |
| 281 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | NHAc  | O              | O              |                              |
| 282 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | NHCOEt  | O              | O              |                              |
| 283 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | NHCO <sup>n</sup> Pr  | O              | O              |                              |
| 284 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | NHCO <sup>i</sup> Pr  | O              | O              |                              |
| 285 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | NHCO <sup>n</sup> Bu  | O              | O              |                              |
| 286 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | NHCO <sup>i</sup> Bu  | O              | O              |                              |
| 287 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | NHCOCF <sub>3</sub>   | O              | O              | 125-126°C                    |
| 288 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | NHCOCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>   | O              | O              |                              |



| No. | (R <sup>1</sup> ) <sub>n</sub> | (R <sup>2</sup> ) <sub>m</sub> | R <sup>3</sup> | R <sup>4</sup>   | X <sub>1</sub> | X <sub>2</sub> | 物性値 (融点)  |
|-----|--------------------------------|--------------------------------|----------------|--|----------------|----------------|-----------|
| 289 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | NHCOOMe  | O              | O              |           |
| 290 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | NHSO <sub>2</sub> Me   | O              | O              |           |
| 291 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | NHSO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>  | O              | O              |           |
| 292 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | NHSO <sub>2</sub> -  -Me      | O              | O              |           |
| 293 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | NHCOPh   | O              | O              |           |
| 294 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | NHCO-  -Cl                    | O              | O              |           |
| 295 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(Me)CHO   | O              | O              |           |
| 296 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(Me)Ac  | O              | O              |           |
| 297 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(Et)Ac  | O              | O              |           |
| 298 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(Me)COEt  | O              | O              |           |
| 299 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(Me)CO <sup>i</sup> Pr  | O              | O              |           |
| 300 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(Me)COCF <sub>3</sub>   | O              | O              |           |
| 301 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(Ac) <sub>2</sub>   | O              | O              |           |
| 302 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(COCF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>   | O              | O              |           |
| 303 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(COEt) <sub>2</sub>   | O              | O              | 119-121°C |
| 304 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(CO <sup>n</sup> Pr) <sub>2</sub>   | O              | O              |           |
| 305 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(CO <sup>i</sup> Pr) <sub>2</sub>   | O              | O              |           |
| 306 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(CO <sup>n</sup> Bu) <sub>2</sub>   | O              | O              |           |
| 307 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(COPh) <sub>2</sub>   | O              | O              |           |
| 308 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(COMe)CHO   | O              | O              |           |
| 309 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(COEt)CHO   | O              | O              |           |
| 310 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(COEt)Ac  | O              | O              | 43-45°C   |
| 311 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(CO <sup>n</sup> Pr)Ac  | O              | O              |           |
| 312 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(CO <sup>i</sup> Pr)Ac  | O              | O              |           |
| 313 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(CO <sup>n</sup> Bu)Ac  | O              | O              |           |
| 314 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(COPh)Ac  | O              | O              |           |
| 315 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(SO <sub>2</sub> Me)Ac  | O              | O              |           |
| 316 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(SO <sub>2</sub> -  -Me)Ac | O              | O              |           |

| No. | (R <sup>1</sup> ) <sub>n</sub> | (R <sup>2</sup> ) <sub>m</sub> | R <sup>3</sup> | R <sup>4</sup>   | X <sub>1</sub> | X <sub>2</sub> | 物性値 (融点) |
|-----|--------------------------------|--------------------------------|----------------|--|----------------|----------------|----------|
| 317 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(COOEt)Ac   | O              | O              |          |
| 318 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(COCF <sub>3</sub> )Ac  | O              | O              |          |
| 319 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(COEt)COCF <sub>3</sub>   | O              | O              |          |
| 320 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(CO <sup>n</sup> Pr)COCF <sub>3</sub>   | O              | O              |          |
| 321 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(CO <sup>n</sup> Pr)COEt  | O              | O              |          |
| 322 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(CO <sup>i</sup> Pr)COEt  | O              | O              |          |
| 323 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(CO <sup>n</sup> Bu)COEt  | O              | O              |          |
| 324 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(CO <sup>i</sup> Pr)CO <sup>n</sup> Pr  | O              | O              |          |
| 325 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(CO <sup>n</sup> Bu)CO <sup>n</sup> Pr  | O              | O              |          |
| 326 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | NHCH <sub>2</sub> Ac   | O              | O              |          |
| 327 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl) <sub>2</sub>                                   | O              | O              |          |
| 328 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | NH  | O              | O              |          |
| 329 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | NHCONHMe   | O              | O              |          |
| 330 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | NHCONMe <sub>2</sub>   | O              | O              |          |
| 331 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | NHCONHEt   | O              | O              |          |
| 332 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | NHCONHPh   | O              | O              |          |
| 333 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | NHCOCH <sub>2</sub> OMe  | O              | O              |          |
| 334 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | NHCOCO <sub>2</sub> Me   | O              | O              |          |
| 335 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(COEt)CO <sub>2</sub> Et  | O              | O              |          |
| 336 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | NHCO(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> Cl   | O              | O              |          |
| 337 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(COEt)COCH <sub>2</sub> OMe   | O              | O              |          |
| 338 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(COEt)CO(CH <sub>2</sub> ) <sub>8</sub> Me  | O              | O              |          |
| 339 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | NHCOCH(Cl)Me   | O              | O              |          |
| 340 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(COEt)CH <sub>2</sub> OAc   | O              | O              |          |
| 341 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | NCS  | O              | O              |          |
| 342 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(COEt)COCO <sub>2</sub> Me  | O              | O              |          |
| 343 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(SO <sub>2</sub> Me) <sub>2</sub>   | O              | O              |          |
| 344 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(COEt)COCH(Cl)Me  | O              | O              |          |

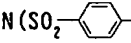

| No. | (R <sup>1</sup> ) <sub>n</sub> | (R <sup>2</sup> ) <sub>m</sub> | R <sup>3</sup> | R <sup>4</sup>  | X <sub>1</sub> | X <sub>2</sub> | 物性値 (融点) |
|-----|--------------------------------|--------------------------------|----------------|---|----------------|----------------|----------|
| 345 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(COEt)COCH <sub>2</sub> OH                               | O              | O              |          |
| 346 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(COEt)(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> CO <sub>2</sub> Et | O              | O              |          |
| 347 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(COCH <sub>2</sub> OMe) <sub>2</sub>                     | O              | O              |          |
| 348 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(COEt)CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> H                  | O              | O              |          |
| 349 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | NHCOCF <sub>2</sub> Cl                                    | O              | O              |          |
| 350 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(COEt)CH <sub>2</sub> C≡CH                               | O              | O              |          |
| 351 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(COCH <sub>2</sub> OMe)COCH(Br)Me                        | O              | O              |          |
| 352 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | NHOH  | O              | O              |          |
| 353 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(COCH <sub>2</sub> OMe)CH(Cl)Me                          | O              | O              |          |
| 354 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(Ac)COCH <sub>2</sub> OMe                                | O              | O              |          |
| 355 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(COCH <sub>2</sub> OMe)COCH <sub>2</sub> OAc             | O              | O              |          |
| 356 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(Et)COEt   | O              | O              |          |
| 357 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(COCH <sub>2</sub> OMe)COCH <sub>2</sub> Cl              | O              | O              |          |
| 358 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(Me)COCH <sub>2</sub> OMe                                | O              | O              |          |
| 359 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(COEt)COCH <sub>2</sub> OEt                              | O              | O              |          |
| 360 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(COCH <sub>2</sub> OMe)CH <sub>2</sub> CN                | O              | O              |          |
| 361 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(COCH <sub>2</sub> OMe)CH <sub>2</sub> OMe               | O              | O              |          |
| 362 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(COCH <sub>2</sub> OMe)CH <sub>2</sub> OAc               | O              | O              |          |
| 363 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(COEt)CH <sub>2</sub> CN                                 | O              | O              |          |
| 364 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(COCH <sub>2</sub> OAc) <sub>2</sub>                     | O              | O              |          |
| 365 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | NHCOCH <sub>2</sub> OEt                                   | O              | O              |          |
| 366 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(COEt)COCH <sub>2</sub> OAc                              | O              | O              |          |
| 367 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(COEt)CO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> | O              | O              |          |
| 368 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(COEt)COC(Me) <sub>2</sub> OAc                           | O              | O              |          |
| 369 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(COEt)CONMe <sub>2</sub>                                 | O              | O              |          |
| 370 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(COEt)CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> Et                 | O              | O              |          |
| 371 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(Me)OH   | O              | O              |          |
| 372 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(COEt)CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>                 | O              | O              |          |

| No. | (R <sup>1</sup> ) <sub>n</sub> | (R <sup>2</sup> ) <sub>m</sub> | R <sup>3</sup> | R <sup>4</sup>   | X <sub>1</sub> | X <sub>2</sub> | 物性値 (融点) |
|-----|--------------------------------|--------------------------------|----------------|--|----------------|----------------|----------|
| 373 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | NH(OMe)  | O              | O              |          |
| 374 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | NHOAc  | O              | O              |          |
| 375 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | NMe(OMe)   | O              | O              |          |
| 376 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(Ac)OAc   | O              | O              |          |
| 377 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(Me)OAc   | O              | O              |          |
| 378 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(Me)OCOCF <sub>3</sub>  | O              | O              |          |
| 379 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(Me)OCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>   | O              | O              |          |
| 380 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N(Me)OCH <sub>2</sub> C≡CH   | O              | O              |          |
| 381 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N=CHMe   | O              | O              |          |
| 382 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N=CMe <sub>2</sub>   | O              | O              |          |
| 383 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N=CH <sup>n</sup> Et   | O              | O              |          |
| 384 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N=CH <sup>n</sup> Pr   | O              | O              |          |
| 385 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N=CHPh   | O              | O              |          |
| 386 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N=CH-       | O              | O              |          |
| 387 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N=CH-       | O              | O              |          |
| 388 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N=CHNMe <sub>2</sub>   | O              | O              |          |
| 389 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N=C(Me)NH <sub>2</sub>   | O              | O              |          |
| 390 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              | N=C(SMe) <sub>2</sub>  | O              | O              |          |
| 391 | 3-CF <sub>3</sub> ,5-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,5-Cl        | H              |             | O              | O              |          |
| 392 | 3-CF <sub>3</sub> ,6-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,6-Cl        | H              | N(COEt)CO-  | O              | O              |          |
| 393 | 3-CF <sub>3</sub> ,7-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,7-Cl        | H              | N(COEt)CO-  | O              | O              |          |
| 394 | 3-CF <sub>3</sub> ,8-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,8-Cl        | H              |             | O              | O              |          |
| 395 | 3-CF <sub>3</sub> ,9-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,9-Cl        | H              | N(COEt)CO-  | O              | O              |          |


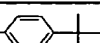
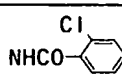


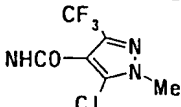
| No. | (R <sup>1</sup> ) <sub>n</sub> | (R <sup>2</sup> ) <sub>m</sub> | R <sup>3</sup> | R <sup>4</sup>  | X <sub>1</sub> | X <sub>2</sub> | 物性値 (融点)      |
|-----|--------------------------------|--------------------------------|----------------|---|----------------|----------------|---------------|
| 396 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              |                | O              | O              |               |
| 397 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              |                | O              | O              |               |
| 398 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              |                | O              | O              |               |
| 399 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              |                | O              | O              |               |
| 400 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              |                | O              | O              |               |
| 401 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              |                | O              | O              |               |
| 402 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              |                | O              | O              |               |
| 403 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              |                | O              | O              |               |
| 404 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | H              |                | O              | O              |               |
| 405 | 3-CF <sub>3</sub> ,5-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,5-Cl        | H              |                | O              | O              |               |
| 406 | 3-CF <sub>3</sub> ,6-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,6-Cl        | H              | N(COEt)CO-N  | O              | O              |               |
| 407 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              | NH <sub>2</sub>   | O              | O              | 140.5-141.5°C |
| 408 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              | NHMe  | O              | O              |               |
| 409 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              | NHEt  | O              | O              |               |
| 410 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              | NH <sup>n</sup> Pr  | O              | O              |               |
| 411 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              | NH <sup>i</sup> Pr  | O              | O              |               |
| 412 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              | NMe <sub>2</sub>  | O              | O              |               |
| 413 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              | NEt <sub>2</sub>  | O              | O              |               |
| 414 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              | N( <sup>i</sup> Pr) <sub>2</sub>  | O              | O              |               |
| 415 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              | NHCHO   | O              | O              |               |
| 416 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              | NHAc  | O              | O              | 160-161°C     |
| 417 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              | NHCOEt  | O              | O              |               |
| 418 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              | NHCO <sup>n</sup> Pr  | O              | O              |               |
| 419 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              | NHCO <sup>i</sup> Pr  | O              | O              |               |
| 420 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              | NHCO <sup>n</sup> Bu  | O              | O              |               |

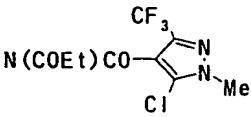











| No. | (R <sup>1</sup> ) <sub>n</sub> | (R <sup>2</sup> ) <sub>m</sub> | R <sup>3</sup> | R <sup>4</sup>  | X <sub>1</sub> | X <sub>2</sub> | 物性値 (融点)  |
|-----|--------------------------------|--------------------------------|----------------|---|----------------|----------------|-----------|
| 421 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              | NHCO <sup>t</sup> Bu  | O              | O              |           |
| 422 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              | NHCOCF <sub>3</sub>   | O              | O              |           |
| 423 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              | NHCOCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>   | O              | O              |           |
| 424 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              | NHCOOMe   | O              | O              |           |
| 425 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              | NHSO <sub>2</sub> Me  | O              | O              |           |
| 426 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              | NHSO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>   | O              | O              |           |
| 427 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              | NHSO <sub>2</sub> -  -Me | O              | O              |           |
| 428 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              | NHCOPh  | O              | O              |           |
| 429 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              | NHCO-  -Cl               | O              | O              |           |
| 430 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              | N(Me)CHO  | O              | O              |           |
| 431 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              | N(Me)Ac   | O              | O              |           |
| 432 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              | N(Et)Ac   | O              | O              |           |
| 433 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              | N(Me)COEt   | O              | O              |           |
| 434 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              | N(Me)CO <sup>i</sup> Pr   | O              | O              |           |
| 435 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              | N(Me)COCF <sub>3</sub>  | O              | O              |           |
| 436 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              | N(Ac) <sub>2</sub>  | O              | O              | 100-102°C |
| 437 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              | N(COCF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>  | O              | O              |           |
| 438 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              | N(COEt) <sub>2</sub>  | O              | O              |           |
| 439 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              | N(CO <sup>n</sup> Pr) <sub>2</sub>  | O              | O              |           |
| 440 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              | N(CO <sup>i</sup> Pr) <sub>2</sub>  | O              | O              |           |
| 441 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              | N(CO <sup>n</sup> Bu) <sub>2</sub>  | O              | O              |           |
| 442 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              | N(COPh) <sub>2</sub>  | O              | O              |           |
| 443 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              | N(COMe)CHO  | O              | O              |           |
| 444 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              | N(COEt)CHO  | O              | O              |           |
| 445 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              | N(COEt)Ac   | O              | O              |           |
| 446 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              | N(CO <sup>n</sup> Pr)Ac   | O              | O              |           |
| 447 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              | N(CO <sup>i</sup> Pr)Ac   | O              | O              |           |
| 448 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              | N(CO <sup>n</sup> Bu)Ac   | O              | O              |           |



| No. | (R <sup>1</sup> ) <sub>n</sub> | (R <sup>2</sup> ) <sub>m</sub> | R <sup>3</sup> | R <sup>4</sup>   | X <sub>1</sub> | X <sub>2</sub> | 物性値(融点) |
|-----|--------------------------------|--------------------------------|----------------|--|----------------|----------------|---------|
| 449 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              | N(COPh)Ac  | O              | O              |         |
| 450 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              | N(SO <sub>2</sub> Me)Ac  | O              | O              |         |
| 451 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              | N(SO <sub>2</sub> -  -Me)Ac | O              | O              |         |
| 452 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              | N(COOEt)Ac   | O              | O              |         |
| 453 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              | N(COCF <sub>3</sub> )Ac  | O              | O              |         |
| 454 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              | N(COEt)COCF <sub>3</sub>   | O              | O              |         |
| 455 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              | N(CO <sup>n</sup> Pr)COCF <sub>3</sub>   | O              | O              |         |
| 456 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              | N(CO <sup>n</sup> Pr)COEt  | O              | O              |         |
| 457 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              | N(CO <sup>i</sup> Pr)COEt  | O              | O              |         |
| 458 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              | N(CO <sup>n</sup> Bu)COEt  | O              | O              |         |
| 459 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              | N(CO <sup>i</sup> Pr)CO <sup>n</sup> Pr  | O              | O              |         |
| 460 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              | N(CO <sup>n</sup> Bu)CO <sup>n</sup> Pr  | O              | O              |         |
| 461 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              | NHCH <sub>2</sub> Ac   | O              | O              |         |
| 462 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              | N(CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl) <sub>2</sub>   | O              | O              |         |
| 463 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              | NH                        | O              | O              |         |
| 464 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              | NHCONHMe   | O              | O              |         |
| 465 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              | NHCONMe <sub>2</sub>   | O              | O              |         |
| 466 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              | NHCONHEt   | O              | O              |         |
| 467 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              | NHCONHPh   | O              | O              |         |
| 468 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              | NHCOCH <sub>2</sub> OMe  | O              | O              |         |
| 469 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              | NHCOCO <sub>2</sub> Me   | O              | O              |         |
| 470 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              | N(COEt)CO <sub>2</sub> Et  | O              | O              |         |
| 471 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              | NHCO(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> Cl   | O              | O              |         |
| 472 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              | N(COEt)COCH <sub>2</sub> OMe   | O              | O              |         |
| 473 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              | N(COEt)CO(CH <sub>2</sub> ) <sub>8</sub> Me  | O              | O              |         |
| 474 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              | NHCOCH(Cl)Me   | O              | O              |         |
| 475 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              | N(COEt)CH <sub>2</sub> OAc   | O              | O              |         |
| 476 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              | NCS  | O              | O              |         |

| No. | (R <sup>1</sup> ) <sub>n</sub> | (R <sup>2</sup> ) <sub>m</sub> | R <sup>3</sup> | R <sup>4</sup>  | X <sub>1</sub> | X <sub>2</sub> | 物性値 (融点) |
|-----|--------------------------------|--------------------------------|----------------|---|----------------|----------------|----------|
| 477 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              | N(COEt)COCO <sub>2</sub> Me                               | O              | O              |          |
| 478 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              | N(SO <sub>2</sub> Me) <sub>2</sub>                        | O              | O              |          |
| 479 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              | N(COEt)COCH(Cl)Me   | O              | O              |          |
| 480 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              | N(COEt)COCH <sub>2</sub> OH                               | O              | O              |          |
| 481 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              | N(COEt)(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> CO <sub>2</sub> Et | O              | O              |          |
| 482 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              | N(COCH <sub>2</sub> OMe) <sub>2</sub>                     | O              | O              |          |
| 483 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              | N(COEt)CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> H                  | O              | O              |          |
| 484 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              | NHCOCF <sub>2</sub> Cl                                    | O              | O              |          |
| 485 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              | N(COEt)CH <sub>2</sub> C≡CH                               | O              | O              |          |
| 486 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              | N(COCH <sub>2</sub> OMe)COCH(Br)Me                        | O              | O              |          |
| 487 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              | NHOH  | O              | O              |          |
| 488 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              | N(COCH <sub>2</sub> OMe)CH(Cl)Me                          | O              | O              |          |
| 489 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              | N(Ac)COCH <sub>2</sub> OMe                                | O              | O              |          |
| 490 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              | N(COCH <sub>2</sub> OMe)COCH <sub>2</sub> OAc             | O              | O              |          |
| 491 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              | N(Et)COEt   | O              | O              |          |
| 492 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              | N(COCH <sub>2</sub> OMe)COCH <sub>2</sub> Cl              | O              | O              |          |
| 493 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              | N(Me)COCH <sub>2</sub> OMe                                | O              | O              |          |
| 494 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              | N(COEt)COCH <sub>2</sub> OEt                              | O              | O              |          |
| 495 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              | N(COCH <sub>2</sub> OMe)CH <sub>2</sub> CN                | O              | O              |          |
| 496 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              | N(COCH <sub>2</sub> OMe)CH <sub>2</sub> OMe               | O              | O              |          |
| 497 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              | N(COCH <sub>2</sub> OMe)CH <sub>2</sub> OAc               | O              | O              |          |
| 498 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              | N(COEt)CH <sub>2</sub> CN                                 | O              | O              |          |
| 499 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              | N(COCH <sub>2</sub> OAc) <sub>2</sub>                     | O              | O              |          |
| 500 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              | NHCOCH <sub>2</sub> OEt                                   | O              | O              |          |
| 501 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              | N(COEt)COCH <sub>2</sub> OAc                              | O              | O              |          |
| 502 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              | N(COEt)CO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> | O              | O              |          |
| 503 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              | N(COEt)COC(Me) <sub>2</sub> OAc                           | O              | O              |          |
| 504 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              | N(COEt)CONMe <sub>2</sub>                                 | O              | O              |          |

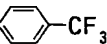
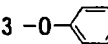
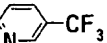
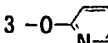
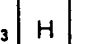

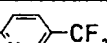
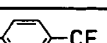
| No. | (R <sup>1</sup> ) <sub>n</sub> | (R <sup>2</sup> ) <sub>m</sub> | R <sup>3</sup> | R <sup>4</sup>   | X <sub>1</sub> | X <sub>2</sub> | 物性値 (融点) |
|-----|--------------------------------|--------------------------------|----------------|--|----------------|----------------|----------|
| 505 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              | N(COEt)CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> Et  | O              | O              |          |
| 506 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              | N(Me)OH  | O              | O              |          |
| 507 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              | N(COEt)CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>  | O              | O              |          |
| 508 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              | NHOMe  | O              | O              |          |
| 509 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              | NHOAc  | O              | O              |          |
| 510 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              | NMe(OMe)   | O              | O              |          |
| 511 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              | N(Ac)OAc   | O              | O              |          |
| 512 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              | N(Me)OAc   | O              | O              |          |
| 513 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              | N(Me)OCOCF <sub>3</sub>  | O              | O              |          |
| 514 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              | N(Me)OCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>   | O              | O              |          |
| 515 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              | N(Me)OCH <sub>2</sub> C≡CH   | O              | O              |          |
| 516 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              | N=CHMe   | O              | O              |          |
| 517 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              | N=CMe <sub>2</sub>   | O              | O              |          |
| 518 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              | N=CH <sup>n</sup> Et   | O              | O              |          |
| 519 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              | N=CH <sup>n</sup> Pr   | O              | O              |          |
| 520 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              | N=CHPh   | O              | O              |          |
| 521 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              | N=CH-       | O              | O              |          |
| 522 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              | N=CH-       | O              | O              |          |
| 523 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              | N=CHNMe <sub>2</sub>   | O              | O              |          |
| 524 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              | N=C(Me)NH <sub>2</sub>   | O              | O              |          |
| 525 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              | N=C(SMe) <sub>2</sub>  | O              | O              |          |
| 526 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              |             | O              | O              |          |
| 527 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              | N(COEt)CO-  | O              | O              |          |
| 528 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              | N(COEt)CO-  | O              | O              |          |
| 529 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              |             | O              | O              |          |

| No. | (R <sup>1</sup> ) <sub>n</sub> | (R <sup>2</sup> ) <sub>m</sub> | R <sup>3</sup> | R <sup>4</sup>  | X <sub>1</sub> | X <sub>2</sub> | 物性値 (融点) |
|-----|--------------------------------|--------------------------------|----------------|---|----------------|----------------|----------|
| 530 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              |               | O              | O              |          |
| 531 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              |                | O              | O              |          |
| 532 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              |                | O              | O              |          |
| 533 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              |                | O              | O              |          |
| 534 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              |                | O              | O              |          |
| 535 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              |                | O              | O              |          |
| 536 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              |                | O              | O              |          |
| 537 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              |                | O              | O              |          |
| 538 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              |                | O              | O              |          |
| 539 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              |               | O              | O              |          |
| 540 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              |              | O              | O              |          |
| 541 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | H              | N(COEt)CO-N  | O              | O              |          |
| 542 | 3-CF <sub>3</sub>              | 3-CF <sub>3</sub>              | H              | NH <sub>2</sub>   | O              | O              |          |
| 543 | 3-CF <sub>3</sub>              | 3-CF <sub>3</sub>              | H              | NHMe  | O              | O              |          |
| 544 | 3-CF <sub>3</sub>              | 3-CF <sub>3</sub>              | H              | NMe <sub>2</sub>  | O              | O              |          |
| 545 | 3-CF <sub>3</sub>              | 3-CF <sub>3</sub>              | H              | NHAc  | O              | O              |          |
| 546 | 3-CF <sub>3</sub>              | 3-CF <sub>3</sub>              | H              | NHCOCF <sub>3</sub>   | O              | O              |          |
| 547 | 3-CF <sub>3</sub>              | 3-CF <sub>3</sub>              | H              | N(Me)Ac   | O              | O              |          |
| 548 | 3-CF <sub>3</sub>              | 3-CF <sub>3</sub>              | H              | N(Me)COCF <sub>3</sub>  | O              | O              |          |
| 549 | 3-CF <sub>3</sub>              | 3-CF <sub>3</sub>              | H              | N(Ac) <sub>2</sub>  | O              | O              |          |
| 550 | 3-CF <sub>3</sub>              | 3-CF <sub>3</sub>              | H              | NHCOOMe   | O              | O              |          |
| 551 | 3-CF <sub>3</sub>              | 3-CF <sub>3</sub>              | H              | NHSO <sub>2</sub> Me  | O              | O              |          |
| 552 | 3-CF <sub>3</sub>              | 3-CF <sub>3</sub>              | H              | NHCOPh  | O              | O              |          |

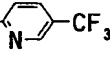
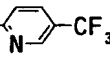
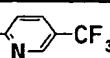
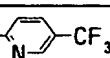
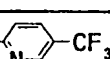
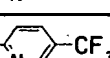
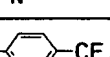
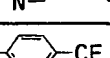
| No. | (R <sup>1</sup> ) <sub>n</sub>       | (R <sup>2</sup> ) <sub>m</sub>       | R <sup>3</sup> | R <sup>4</sup>                      | X <sub>1</sub> | X <sub>2</sub> | 物性値 (融点)                     |
|-----|--------------------------------------|--------------------------------------|----------------|-------------------------------------|----------------|----------------|------------------------------|
| 553 | 3-CF <sub>3</sub>                    | 3-CF <sub>3</sub>                    | H              | N(COPh) <sub>2</sub>                | O              | O              |                              |
| 554 | 3-CF <sub>3</sub>                    | 3-CF <sub>3</sub>                    | H              | N(COEt)Ac                           | O              | O              |                              |
| 555 | 3-CF <sub>3</sub>                    | 3-CF <sub>3</sub>                    | H              | N(CO <sup>n</sup> Pr)Ac             | O              | O              |                              |
| 556 | 3-CF <sub>3</sub>                    | 3-CF <sub>3</sub>                    | H              | N=CHMe                              | O              | O              |                              |
| 557 | 3-CF <sub>3</sub>                    | 3-CF <sub>3</sub>                    | H              | N=CHPh                              | O              | O              |                              |
| 558 | 3-CF <sub>3</sub> ,5-CF <sub>3</sub> | 3-CF <sub>3</sub> ,5-CF <sub>3</sub> | H              | NH <sub>2</sub>                     | O              | O              | 105-106°C                    |
| 559 | 3-CF <sub>3</sub> ,5-CF <sub>3</sub> | 3-CF <sub>3</sub> ,5-CF <sub>3</sub> | H              | NHMe                                | O              | O              |                              |
| 560 | 3-CF <sub>3</sub> ,5-CF <sub>3</sub> | 3-CF <sub>3</sub> ,5-CF <sub>3</sub> | H              | NHAc                                | O              | O              |                              |
| 561 | 3-CF <sub>3</sub> ,5-CF <sub>3</sub> | 3-CF <sub>3</sub> ,5-CF <sub>3</sub> | H              | NHCOCF <sub>3</sub>                 | O              | O              |                              |
| 562 | 3-CF <sub>3</sub> ,5-CF <sub>3</sub> | 3-CF <sub>3</sub> ,5-CF <sub>3</sub> | H              | NHCOCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | O              | O              |                              |
| 563 | 3-CF <sub>3</sub> ,5-CF <sub>3</sub> | 3-CF <sub>3</sub> ,5-CF <sub>3</sub> | H              | N(Ac) <sub>2</sub>                  | O              | O              |                              |
| 564 | 3-CF <sub>3</sub> ,5-CF <sub>3</sub> | 3-CF <sub>3</sub> ,5-CF <sub>3</sub> | H              | N(COEt) <sub>2</sub>                | O              | O              |                              |
| 565 | 3-CF <sub>3</sub> ,5-CF <sub>3</sub> | 3-CF <sub>3</sub> ,5-CF <sub>3</sub> | H              | N(CO <sup>n</sup> Pr) <sub>2</sub>  | O              | O              |                              |
| 566 | 3-CF <sub>3</sub> ,5-CF <sub>3</sub> | 3-CF <sub>3</sub> ,5-CF <sub>3</sub> | H              | N(CO <sup>i</sup> Pr) <sub>2</sub>  | O              | O              |                              |
| 567 | 3-CF <sub>3</sub> ,5-CF <sub>3</sub> | 3-CF <sub>3</sub> ,5-CF <sub>3</sub> | H              | N(COEt)Ac                           | O              | O              |                              |
| 568 | 3-CF <sub>3</sub> ,5-CF <sub>3</sub> | 3-CF <sub>3</sub> ,5-CF <sub>3</sub> | H              | N(CO <sup>n</sup> Pr)Ac             | O              | O              |                              |
| 569 | 3-CF <sub>3</sub> ,5-CF <sub>3</sub> | 3-CF <sub>3</sub> ,5-CF <sub>3</sub> | H              | N(CO <sup>n</sup> Pr)COEt           | O              | O              |                              |
| 570 | 3-CF <sub>3</sub> ,5-F               | 3-CF <sub>3</sub> ,5-F               | H              | NH <sub>2</sub>                     | O              | O              | 96.5-97.5°C                  |
| 571 | 3-CF <sub>3</sub> ,5-F               | 3-CF <sub>3</sub> ,5-F               | H              | NHMe                                | O              | O              |                              |
| 572 | 3-CF <sub>3</sub> ,5-F               | 3-CF <sub>3</sub> ,5-F               | H              | NHAc                                | O              | O              |                              |
| 573 | 3-CF <sub>3</sub> ,5-F               | 3-CF <sub>3</sub> ,5-F               | H              | NHCOCF <sub>3</sub>                 | O              | O              | アモルファス <sup>1</sup> H-NMR(g) |
| 574 | 3-CF <sub>3</sub> ,5-F               | 3-CF <sub>3</sub> ,5-F               | H              | NHCOCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | O              | O              |                              |
| 575 | 3-CF <sub>3</sub> ,5-F               | 3-CF <sub>3</sub> ,5-F               | H              | N(Ac) <sub>2</sub>                  | O              | O              |                              |
| 576 | 3-CF <sub>3</sub> ,5-F               | 3-CF <sub>3</sub> ,5-F               | H              | N(COEt) <sub>2</sub>                | O              | O              |                              |
| 577 | 3-CF <sub>3</sub> ,5-F               | 3-CF <sub>3</sub> ,5-F               | H              | N(CO <sup>n</sup> Pr) <sub>2</sub>  | O              | O              |                              |
| 578 | 3-CF <sub>3</sub> ,5-F               | 3-CF <sub>3</sub> ,5-F               | H              | N(CO <sup>i</sup> Pr) <sub>2</sub>  | O              | O              |                              |
| 579 | 3-CF <sub>3</sub> ,5-F               | 3-CF <sub>3</sub> ,5-F               | H              | N(COEt)Ac                           | O              | O              |                              |
| 580 | 3-CF <sub>3</sub> ,5-F               | 3-CF <sub>3</sub> ,5-F               | H              | N(CO <sup>n</sup> Pr)Ac             | O              | O              |                              |

| No. | (R <sup>1</sup> ) <sub>n</sub>       | (R <sup>2</sup> ) <sub>m</sub>       | R <sup>3</sup> | R <sup>4</sup>                      | X <sub>1</sub> | X <sub>2</sub> | 物性値 (融点) |
|-----|--------------------------------------|--------------------------------------|----------------|-------------------------------------|----------------|----------------|----------|
| 581 | 3-CF <sub>3</sub> ,5-F               | 3-CF <sub>3</sub> ,5-F               | H              | N(CO <sup>n</sup> Pr)COEt           | O              | O              |          |
| 582 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-I               | 3-CF <sub>3</sub> ,4-I               | H              | NH <sub>2</sub>                     | O              | O              |          |
| 583 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-I               | 3-CF <sub>3</sub> ,4-I               | H              | NHMe                                | O              | O              |          |
| 584 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-I               | 3-CF <sub>3</sub> ,4-I               | H              | NHAc                                | O              | O              |          |
| 585 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-I               | 3-CF <sub>3</sub> ,4-I               | H              | NHCOCF <sub>3</sub>                 | O              | O              |          |
| 586 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-I               | 3-CF <sub>3</sub> ,4-I               | H              | NHCOCF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> | O              | O              |          |
| 587 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-I               | 3-CF <sub>3</sub> ,4-I               | H              | N(Ac) <sub>2</sub>                  | O              | O              |          |
| 588 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-I               | 3-CF <sub>3</sub> ,4-I               | H              | N(COEt) <sub>2</sub>                | O              | O              |          |
| 589 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-I               | 3-CF <sub>3</sub> ,4-I               | H              | N(CO <sup>n</sup> Pr) <sub>2</sub>  | O              | O              |          |
| 590 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-I               | 3-CF <sub>3</sub> ,4-I               | H              | N(CO <sup>i</sup> Pr) <sub>2</sub>  | O              | O              |          |
| 591 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-I               | 3-CF <sub>3</sub> ,4-I               | H              | N(COEt)Ac                           | O              | O              |          |
| 592 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-I               | 3-CF <sub>3</sub> ,4-I               | H              | N(CO <sup>n</sup> Pr)Ac             | O              | O              |          |
| 593 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-I               | 3-CF <sub>3</sub> ,4-I               | H              | N(CO <sup>n</sup> Pr)COEt           | O              | O              |          |
| 594 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F               | 3-CF <sub>3</sub>                    | H              | NH <sub>2</sub>                     | O              | O              |          |
| 595 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F               | 3-CF <sub>3</sub>                    | H              | NHMe                                | O              | O              |          |
| 596 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F               | 3-CF <sub>3</sub>                    | H              | NMe <sub>2</sub>                    | O              | O              |          |
| 597 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F               | 3-CF <sub>3</sub>                    | H              | NHAc                                | O              | O              |          |
| 598 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F               | 3-CF <sub>3</sub>                    | H              | NHCOCF <sub>3</sub>                 | O              | O              |          |
| 599 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F               | 3-CF <sub>3</sub>                    | H              | NHSO <sub>2</sub> Me                | O              | O              |          |
| 600 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F               | 3-CF <sub>3</sub>                    | H              | NHCOPh                              | O              | O              |          |
| 601 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F               | 3-CF <sub>3</sub>                    | H              | N(Ac) <sub>2</sub>                  | O              | O              |          |
| 602 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F               | 3-CF <sub>3</sub>                    | H              | N(COCF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>  | O              | O              |          |
| 603 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F               | 3-CF <sub>3</sub>                    | H              | N(COEt) <sub>2</sub>                | O              | O              |          |
| 604 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F               | 3-CF <sub>3</sub>                    | H              | N(CO <sup>i</sup> Pr) <sub>2</sub>  | O              | O              |          |
| 605 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F               | 3-CF <sub>3</sub>                    | H              | N(CO <sup>n</sup> Pr)Ac             | O              | O              |          |
| 606 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-CF <sub>3</sub> | 3-CF <sub>3</sub> ,4-CF <sub>3</sub> | H              | NH <sub>2</sub>                     | O              | O              |          |
| 607 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-CF <sub>3</sub> | 3-CF <sub>3</sub> ,4-CF <sub>3</sub> | H              | NHCOCF <sub>3</sub>                 | O              | O              |          |
| 608 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-CF <sub>3</sub> | 3-CF <sub>3</sub> ,4-CF <sub>3</sub> | H              | N(Ac) <sub>2</sub>                  | O              | O              |          |

| No. | (R <sup>1</sup> ) <sub>n</sub>        | (R <sup>2</sup> ) <sub>m</sub>        | R <sup>3</sup> | R <sup>4</sup>      | X <sub>1</sub> | X <sub>2</sub> | 物性値 (融点) |
|-----|---------------------------------------|---------------------------------------|----------------|---------------------|----------------|----------------|----------|
| 609 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-CF <sub>3</sub>  | 3-CF <sub>3</sub> ,4-CF <sub>3</sub>  | H              | N(COEt)Ac           | O              | O              |          |
| 610 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-OCF <sub>3</sub> | 3-CF <sub>3</sub> ,4-OCF <sub>3</sub> | H              | NH <sub>2</sub>     | O              | O              |          |
| 611 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-OCF <sub>3</sub> | 3-CF <sub>3</sub> ,4-OCF <sub>3</sub> | H              | NHCOCF <sub>3</sub> | O              | O              |          |
| 612 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-OCF <sub>3</sub> | 3-CF <sub>3</sub> ,4-OCF <sub>3</sub> | H              | N(Ac) <sub>2</sub>  | O              | O              |          |
| 613 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-OCF <sub>3</sub> | 3-CF <sub>3</sub> ,4-OCF <sub>3</sub> | H              | N(COEt)Ac           | O              | O              |          |
| 614 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-NO <sub>2</sub>  | 3-CF <sub>3</sub> ,4-NO <sub>2</sub>  | H              | NH <sub>2</sub>     | O              | O              |          |
| 615 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-NO <sub>2</sub>  | 3-CF <sub>3</sub> ,4-NO <sub>2</sub>  | H              | NHCOCF <sub>3</sub> | O              | O              |          |
| 616 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-NO <sub>2</sub>  | 3-CF <sub>3</sub> ,4-NO <sub>2</sub>  | H              | N(Ac) <sub>2</sub>  | O              | O              |          |
| 617 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-NO <sub>2</sub>  | 3-CF <sub>3</sub> ,4-NO <sub>2</sub>  | H              | N(COEt)Ac           | O              | O              |          |
| 618 | 3-CF <sub>3</sub> ,5-Cl               | 3-CF <sub>3</sub> ,5-Cl               | H              | NH <sub>2</sub>     | O              | O              |          |
| 619 | 3-CF <sub>3</sub> ,5-Cl               | 3-CF <sub>3</sub> ,5-Cl               | H              | NHCOCF <sub>3</sub> | O              | O              |          |
| 620 | 3-CF <sub>3</sub> ,5-Cl               | 3-CF <sub>3</sub> ,5-Cl               | H              | N(Ac) <sub>2</sub>  | O              | O              |          |
| 621 | 3-CF <sub>3</sub> ,5-Cl               | 3-CF <sub>3</sub> ,5-Cl               | H              | N(COEt)Ac           | O              | O              |          |
| 622 | 3-CF <sub>3</sub> ,5-OCF <sub>3</sub> | 3-CF <sub>3</sub> ,5-OCF <sub>3</sub> | H              | NH <sub>2</sub>     | O              | O              |          |
| 623 | 3-CF <sub>3</sub> ,5-OCF <sub>3</sub> | 3-CF <sub>3</sub> ,5-OCF <sub>3</sub> | H              | NHCOCF <sub>3</sub> | O              | O              |          |
| 624 | 3-CF <sub>3</sub> ,5-OCF <sub>3</sub> | 3-CF <sub>3</sub> ,5-OCF <sub>3</sub> | H              | N(Ac) <sub>2</sub>  | O              | O              |          |
| 625 | 3-CF <sub>3</sub> ,5-OCF <sub>3</sub> | 3-CF <sub>3</sub> ,5-OCF <sub>3</sub> | H              | N(COEt)Ac           | O              | O              |          |
| 626 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl               | 3-CF <sub>3</sub>                     | H              | NH <sub>2</sub>     | O              | O              |          |
| 627 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl               | 3-CF <sub>3</sub>                     | H              | NHCOCF <sub>3</sub> | O              | O              |          |
| 628 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl               | 3-CF <sub>3</sub>                     | H              | N(Ac) <sub>2</sub>  | O              | O              |          |
| 629 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl               | 3-CF <sub>3</sub>                     | H              | N(COEt)Ac           | O              | O              |          |
| 630 | 3-OCF <sub>3</sub> ,4-F               | 3-OCF <sub>3</sub> ,4-F               | H              | NH <sub>2</sub>     | O              | O              |          |
| 631 | 3-OCF <sub>3</sub> ,4-Cl              | 3-OCF <sub>3</sub> ,4-Cl              | H              | NH <sub>2</sub>     | O              | O              |          |
| 632 | 3-CH <sub>3</sub> ,4-F                | 3-CH <sub>3</sub> ,4-F                | H              | NH <sub>2</sub>     | O              | O              |          |
| 633 | 3-CH <sub>2</sub> F,4-F               | 3-CH <sub>2</sub> F,4-F               | H              | NH <sub>2</sub>     | O              | O              |          |
| 634 | 3-CHF <sub>2</sub> ,4-F               | 3-CHF <sub>2</sub> ,4-F               | H              | NH <sub>2</sub>     | O              | O              |          |
| 635 | 3-CF <sub>2</sub> Cl,4-F              | 3-CF <sub>2</sub> Cl,4-F              | H              | NH <sub>2</sub>     | O              | O              |          |
| 636 | 3-CF <sub>2</sub> Br,4-F              | 3-CF <sub>2</sub> Br,4-F              | H              | NH <sub>2</sub>     | O              | O              |          |

| No. | (R <sup>1</sup> ) <sub>n</sub>  | (R <sup>2</sup> ) <sub>m</sub>  | R <sup>3</sup> | R <sup>4</sup>      | X <sub>1</sub> | X <sub>2</sub> | 物性値(融点)                      |
|-----|---|---|----------------|---------------------|----------------|----------------|------------------------------|
| 637 | 3-OCH <sub>3</sub> ,4-F   | 3-OCH <sub>3</sub> ,4-F   | H              | NH <sub>2</sub>     | O              | O              |                              |
| 638 | 3-CCl <sub>3</sub>  | 3-CCl <sub>3</sub>  | H              | NH <sub>2</sub>     | O              | O              |                              |
| 639 | 3-NO <sub>2</sub>   | 3-NO <sub>2</sub>   | H              | NH <sub>2</sub>     | O              | O              |                              |
| 640 | 3-CN  | 3-CN  | H              | NH <sub>2</sub>     | O              | O              |                              |
| 641 | 3-SO <sub>2</sub> Me  | 3-SO <sub>2</sub> Me  | H              | NH <sub>2</sub>     | O              | O              |                              |
| 642 | 3-Oph   | 3-Oph   | H              | NH <sub>2</sub>     | O              | O              |                              |
| 643 | 3-O-  -CF <sub>3</sub> | 3-O-  -CF <sub>3</sub>   | H              | NH <sub>2</sub>     | O              | O              |                              |
| 644 | 3-O-  -CF <sub>3</sub> | 3-O-  -CF <sub>3</sub>   | H              | NH <sub>2</sub>     | O              | O              |                              |
| 645 | 3-SMe   | 3-SMe   | H              | NH <sub>2</sub>     | O              | O              |                              |
| 646 | 4-CF <sub>3</sub>   | 4-CF <sub>3</sub>   | H              | NH <sub>2</sub>     | O              | O              |                              |
| 647 | 3-F,4-CF <sub>3</sub>   | 3-F,4-CF <sub>3</sub>   | H              | NH <sub>2</sub>     | O              | O              |                              |
| 648 | 3-F,4-OCF <sub>3</sub>  | 4-OCF <sub>3</sub>  | H              | NH <sub>2</sub>     | O              | O              |                              |
| 649 | 3-F,4-OCF <sub>3</sub>  | 3-F,4-OCF <sub>3</sub>  | H              | NH <sub>2</sub>     | O              | O              |                              |
| 650 | 3,5-F <sub>2</sub>  | 3,5-F <sub>2</sub>  | H              | NH <sub>2</sub>     | O              | O              |                              |
| 651 | 3,5-Cl <sub>2</sub>   | 3,5-Cl <sub>2</sub>   | H              | NH <sub>2</sub>     | O              | O              |                              |
| 652 | 3,4-F <sub>2</sub>  | 3,4-F <sub>2</sub>  | H              | NH <sub>2</sub>     | O              | O              |                              |
| 653 | 3,4-Cl <sub>2</sub>   | 3,4-Cl <sub>2</sub>   | H              | NH <sub>2</sub>     | O              | O              |                              |
| 654 | 4-NO <sub>2</sub>   | 4-NO <sub>2</sub>   | H              | NH <sub>2</sub>     | O              | O              |                              |
| 655 | 4-CN  | 4-CN  | H              | NH <sub>2</sub>     | O              | O              |                              |
| 656 | 4-SO <sub>2</sub> Me  | 4-SO <sub>2</sub> Me  | H              | NH <sub>2</sub>     | O              | O              |                              |
| 657 | 3-NO <sub>2</sub> ,4-F  | 3-NO <sub>2</sub> ,4-F  | H              | NH <sub>2</sub>     | O              | O              |                              |
| 658 | 3,4,5-F <sub>3</sub>  | 3,4,5-F <sub>3</sub>  | H              | NH <sub>2</sub>     | O              | O              |                              |
| 659 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F  | 4-O-  -CF <sub>3</sub> | H              | NH <sub>2</sub>     | O              | O              | 127-128°C                    |
| 660 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F  | 4-O-  -CF <sub>3</sub> | H              | NHCOCF <sub>3</sub> | O              | O              | 57-59°C                      |
| 661 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F  | 3-O-  -CF <sub>3</sub> | H              | NH <sub>2</sub>     | O              | O              | アモルファス <sup>1</sup> H-NMR(h) |
| 662 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F  | 3-O-  -CF <sub>3</sub> | H              | NHCOCF <sub>3</sub> | O              | O              | 51-53°C                      |



| No. | (R <sup>1</sup> ) <sub>n</sub> | (R <sup>2</sup> ) <sub>m</sub>  | R <sup>3</sup> | R <sup>4</sup>                     | X <sub>1</sub> | X <sub>2</sub> | 物性値(融点)               |
|-----|--------------------------------|---|----------------|------------------------------------|----------------|----------------|-----------------------|
| 663 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 4-O-  -CF <sub>3</sub> | H              | NH <sub>2</sub>                    | O              | O              |                       |
| 664 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 4-O-  -CF <sub>3</sub> | H              | NHCOCF <sub>3</sub>                | O              | O              |                       |
| 665 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-O-  -CF <sub>3</sub> | H              | NH <sub>2</sub>                    | O              | O              |                       |
| 666 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Cl        | 3-O-  -CF <sub>3</sub> | H              | NHCOCF <sub>3</sub>                | O              | O              |                       |
| 667 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 4-O-  -CF <sub>3</sub> | H              | NH <sub>2</sub>                    | O              | O              |                       |
| 668 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 4-O-  -CF <sub>3</sub> | H              | NHCOCF <sub>3</sub>                | O              | O              |                       |
| 669 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-O-  -CF <sub>3</sub> | H              | NH <sub>2</sub>                    | O              | O              |                       |
| 670 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-Br        | 3-O-  -CF <sub>3</sub> | H              | NHCOCF <sub>3</sub>                | O              | O              |                       |
| 671 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F  | H              | NH <sub>2</sub>                    | O              | NH             | 146.5-147.5°C         |
| 672 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F  | H              | NHMe                               | O              | NH             |                       |
| 673 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F  | H              | NMe <sub>2</sub>                   | O              | NH             |                       |
| 674 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F  | H              | NHAc                               | O              | NH             |                       |
| 675 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F  | H              | NHCOCF <sub>3</sub>                | O              | NH             |                       |
| 676 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F  | H              | NHSO <sub>2</sub> Me               | O              | NH             |                       |
| 677 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F  | H              | NHCOPh                             | O              | NH             |                       |
| 678 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F  | H              | N(Me)Ac                            | O              | NH             |                       |
| 679 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F  | H              | N(Me)COCF <sub>3</sub>             | O              | NH             |                       |
| 680 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F  | H              | N(Ac) <sub>2</sub>                 | O              | NH             |                       |
| 681 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F  | H              | N(COCF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | O              | NH             |                       |
| 682 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F  | H              | NH <sub>2</sub>                    | O              | NMe            | <sup>1</sup> H-NMR(i) |
| 683 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F  | H              | NHMe                               | O              | NMe            |                       |
| 684 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F  | H              | NMe <sub>2</sub>                   | O              | NMe            |                       |
| 685 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F  | H              | NHAc                               | O              | NMe            |                       |
| 686 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F  | H              | NHCOCF <sub>3</sub>                | O              | NMe            | アモルファス                |
| 687 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F  | H              | NHSO <sub>2</sub> Me               | O              | NMe            |                       |

| No. | (R <sup>1</sup> ) <sub>n</sub> | (R <sup>2</sup> ) <sub>m</sub> | R <sup>3</sup> | R <sup>4</sup>                     | X <sub>1</sub> | X <sub>2</sub> | 物性値 (融点)  |
|-----|--------------------------------|--------------------------------|----------------|------------------------------------|----------------|----------------|-----------|
| 688 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              | NHCOPh                             | O              | NMe            |           |
| 689 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              | N(Me)Ac                            | O              | NMe            |           |
| 690 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              | N(Me)COCF <sub>3</sub>             | O              | NMe            |           |
| 691 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              | N(Ac) <sub>2</sub>                 | O              | NMe            |           |
| 692 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              | N(COCF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | O              | NMe            |           |
| 693 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              | N(COEt) <sub>2</sub>               | O              | NMe            | 129-130°C |
| 694 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              | NH <sub>2</sub>                    | O              | NAc            |           |
| 695 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              | NHMe                               | O              | NAc            |           |
| 696 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              | NMe <sub>2</sub>                   | O              | NAc            |           |
| 697 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              | NHAc                               | O              | NAc            |           |
| 698 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              | NHCOCF <sub>3</sub>                | O              | NAc            |           |
| 699 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              | NHSO <sub>2</sub> Me               | O              | NAc            |           |
| 700 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              | NHCOPh                             | O              | NAc            |           |
| 701 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              | N(Me)Ac                            | O              | NAc            |           |
| 702 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              | N(Me)COCF <sub>3</sub>             | O              | NAc            |           |
| 703 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              | N(Ac) <sub>2</sub>                 | O              | NAc            |           |
| 704 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              | N(COCF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | O              | NAc            |           |
| 705 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              | NH <sub>2</sub>                    | NH             | NH             |           |
| 706 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              | NH <sub>2</sub>                    | NMe            | NMe            | 127-128°C |
| 707 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              | NH <sub>2</sub>                    | NAc            | NAc            |           |
| 708 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              | N(Ac) <sub>2</sub>                 | NAc            | NAc            |           |
| 709 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | Cl             | NH <sub>2</sub>                    | NAc            | O              |           |
| 710 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | Cl             | N(Ac) <sub>2</sub>                 | NAc            | O              |           |
| 711 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | Cl             | NHCOCF <sub>3</sub>                | NAc            | O              |           |
| 712 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | F              | NH <sub>2</sub>                    | NAc            | O              |           |
| 713 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | Cl             | NH <sub>2</sub>                    | NAc            | NH             |           |
| 714 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | Cl             | NH <sub>2</sub>                    | NMe            | NMe            |           |
| 715 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | Cl             | N(Ac) <sub>2</sub>                 | NAc            | NMe            |           |

| No. | (R <sup>1</sup> ) <sub>n</sub> | (R <sup>2</sup> ) <sub>m</sub> | R <sup>3</sup> | R <sup>4</sup>   | X <sub>1</sub> | X <sub>2</sub> | 物性値(融点) |
|-----|--------------------------------|--------------------------------|----------------|--|----------------|----------------|---------|
| 716 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | Cl             | NH <sub>2</sub>  | NAc            | NAc            |         |
| 717 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | Cl             | N(Ac) <sub>2</sub>                                       | NAc            | NAc            |         |
| 718 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | F              | NH <sub>2</sub>  | NAc            | NH             |         |
| 719 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              | NCO  | O              | O              |         |
| 716 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              | NHSMc  | O              | O              |         |
| 717 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              | N(COEt)CH <sub>2</sub> C≡CCl                             | O              | O              |         |
| 718 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              | N(COCH <sub>2</sub> OMe)CH <sub>2</sub> OCF <sub>3</sub> | O              | O              |         |
| 719 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              | N(COEt)CO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C≡CH              | O              | O              |         |
| 718 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              | N(COEt)CH <sub>2</sub> CH=CHCl                           | O              | O              |         |
| 719 | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | 3-CF <sub>3</sub> ,4-F         | H              | N=C(OMe) <sub>2</sub>                                    | O              | O              |         |

- (a) <sup>1</sup>H-NMR(CDCl<sub>3</sub>,300MHz)  
 $\delta$  3.0ppm(s,6H) , 7.23~7.45ppm(m,6H) , 8.05ppm(s,1H)
- (b) <sup>1</sup>H-NMR(CDCl<sub>3</sub>,300MHz)  
 $\delta$  3.45ppm(s,3H,CH<sub>3</sub>) , 7.27~7.45ppm(m,6H) , 8.32ppm(s,1H)
- (c) <sup>1</sup>H-NMR(CDCl<sub>3</sub>,300MHz)  
 $\delta$  0.87ppm(t,3H) , 1.17~1.43ppm(m,15H) , 1.68~1.79ppm(m,2H)  
7.22~7.42ppm(m,6H) , 8.35(s,1H)
- (d) <sup>1</sup>H-NMR(CDCl<sub>3</sub>,300MHz)  
 $\delta$  1.22ppm(t,3H) , 2.39ppm(q,2H) , 4.55ppm(s,2H) , 7.19~7.40ppm(m,6H) ,  
8.30ppm(s,2H)
- (e) <sup>1</sup>H-NMR(CDCl<sub>3</sub>,300MHz)  
 $\delta$  4.04ppm(br.s,3H) , 7.23~7.47ppm(m,6H) , 7.85ppm(s,1H)
- (f) <sup>1</sup>H-NMR(CDCl<sub>3</sub>,300MHz)  
 $\delta$  4.06ppm(br.s,2H,NH<sub>2</sub>) , 7.24~7.59ppm(m,6H) , 7.85ppm(s,1H)
- (g) <sup>1</sup>H-NMR(CDCl<sub>3</sub>,300MHz)  
 $\delta$  7.14~7.35ppm(m,6H) , 7.99ppm(br.s,1H,NH) , 8.33ppm(s,1H)
- (h) <sup>1</sup>H-NMR(CDCl<sub>3</sub>,300MHz)  
 $\delta$  4.05ppm(br.s,2H) , 7.04~7.16ppm(m,4H) , 7.21~7.31ppm(m,1H)  
7.35~7.53ppm(m,3H) , 7.85~7.96ppm(m,2H) , 8.46ppm(s,1H)
- (i) <sup>1</sup>H-NMR(CDCl<sub>3</sub>,300MHz)  
 $\delta$  3.50ppm(s,5H,NCH<sub>3</sub>,NH<sub>2</sub>) , 7.04~7.48ppm(m,6H) , 7.85ppm(s,1H)

## 〔殺虫・殺ダニ剤〕

次に、本発明の組成物の実施例を若干示すが、添加物及び添加割合は、これら実施例に限定されるべきものではなく、広範囲に変化させることが可能である。製剤実施例中の部は重量部を示す。

## 実施例 1 1 水和剤

|                 |       |
|-----------------|-------|
| 本発明化合物          | 4 0 部 |
| 珪藻土             | 5 3 部 |
| 高級アルコール硫酸エステル   | 4 部   |
| アルキルナフタレンスルホン酸塩 | 3 部   |

以上を均一に混合して微細に粉碎すれば、有効成分 4 0 % の水和剤を得る。

## 実施例 1 2 乳剤

|                      |       |
|----------------------|-------|
| 本発明化合物               | 3 0 部 |
| キシレン                 | 3 3 部 |
| ジメチルホルムアミド           | 3 0 部 |
| ポリオキシエチレンアルキルアリルエーテル | 7 部   |

以上を混合溶解すれば、有効成分 3 0 % の乳剤を得る。

## 実施例 1 3 粉剤

|                      |       |
|----------------------|-------|
| 本発明化合物               | 1 0 部 |
| タルク                  | 8 9 部 |
| ポリオキシエチレンアルキルアリルエーテル | 1 部   |

以上を均一に混合して微細に粉碎すれば、有効成分 1 0 % の粉剤を得る。

## 実施例 1 4 粒剤

|        |       |
|--------|-------|
| 本発明化合物 | 5 部   |
| クレー    | 7 3 部 |
| ベントナイト | 2 0 部 |

ジオクチルスルホサキシネートナトリウム塩 1 部

リン酸ナトリウム 1 部

以上をよく粉碎混合し、水を加えてよく練り合せた後、造粒乾燥して有効成分 5 % の粒剤を得る。

#### 実施例 15

本発明化合物 10 部

リグニンスルホン酸ナトリウム 4 部

ドデシルベンゼンスルホン酸ナトリウム 1 部

キサントガム 0.2 部

水 84.8 部

以上を混合し、粒度が 1 ミクロン以下になるまで湿式粉碎すれば、有効成分 10 % の懸濁液を得る。

## 発明の効果

## 試験例 1 ナミダハダニに対する効力

2 寸鉢に播種したインゲンの発芽後 7 ～ 10 日を経過した第 1 本葉上に、有機燐剤抵抗性のナミダハダニの雌成虫を 17 頭接種したのち、前記薬剤の実施例 7 に示された水和剤の処方に従い、化合物濃度が 125 ppm になるように水で希釈した薬液を散布した。温度 25℃、湿度 65% の恒温室内に置き、散布 3 日後に、成虫を除去し、この 3 日間に産付された卵に関し、成虫まで発育し得たか否かを 11 日目に調査し、殺ダニ有効度を求めた。その結果を第 2 表にまとめた。

なお、殺ダニ有効度は、次式により求めた。

$$\text{殺ダニ有効度 (\%)} = \frac{\text{無処理区成虫数} - \text{処理区成虫数}}{\text{無処理区成虫数}} \times 100$$

## 試験例 2 アワヨトウに対する効力

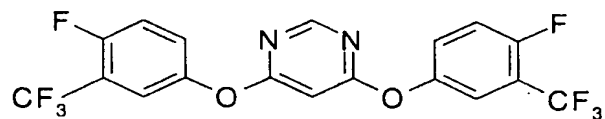
前記の薬剤の実施例 7 に示された水和剤の処方に従い、化合物濃度が 125 ppm になるように水で希釈した。その薬液中にトウモロコシ葉を 30 秒間浸漬し、風乾後、アワヨトウ 2 令幼虫が 5 頭入っているシャーレにその葉を入れた。ガラス蓋をして温度 25℃、湿度 65% の恒温室内に置き、6 日後に殺虫率を調べた。2 反復である。その結果を第 2 表にまとめた。

第 2 表

| 化合物番号 | アワヨトウ<br>5日後殺虫率<br>125ppm | ナミハダニ<br>14日後有効度<br>125ppm |
|-------|---------------------------|----------------------------|
| 1     | 100                       | 100                        |
| 6     | 100                       | -                          |
| 10    | 100                       | 100                        |
| 11    | 100                       | 100                        |
| 16    | 100                       | 100                        |
| 17    | 100                       | 100                        |
| 31    | 100                       | 100                        |
| 33    | 100                       | 100                        |
| 40    | 100                       | 100                        |
| 41    | 100                       | 100                        |
| 42    | 100                       | -                          |
| 51    | 100                       | 100                        |
| 52    | 100                       | -                          |
| 63    | 100                       | 100                        |
| 67    | 100                       | 100                        |
| 69    | 100                       | 100                        |
| 70    | 100                       | 100                        |
| 72    | 100                       | 100                        |
| 77    | 100                       | 100                        |
| 79    | 100                       | 100                        |
| 82    | 100                       | 100                        |
| 83    | 100                       | 100                        |
| 84    | 100                       | 100                        |
| 85    | 100                       | 100                        |
| 87    | 100                       | 100                        |
| 88    | 100                       | -                          |

|          |     |     |
|----------|-----|-----|
| 89       | 100 | 100 |
| 91       | 100 | 100 |
| 92       | 100 | 100 |
| 95       | 100 | 100 |
| 96       | 100 | 100 |
| 101      | 100 | 100 |
| 123      | 100 | —   |
| 137      | 100 | 100 |
| 147      | 100 | —   |
| 152      | 100 | 100 |
| 166      | 100 | 100 |
| 175      | 100 | 100 |
| 272      | 100 | 100 |
| 287      | 100 | 100 |
| 303      | 100 | 100 |
| 310      | 100 | 100 |
| 407      | 100 | 100 |
| 558      | 100 | —   |
| 570      | 100 | 100 |
| 573      | 100 | —   |
| 682      | 100 | 100 |
| 対照化合物    |     |     |
| クロルジメホルム | 40  | 55  |
| 化合物A     | 50  | 100 |

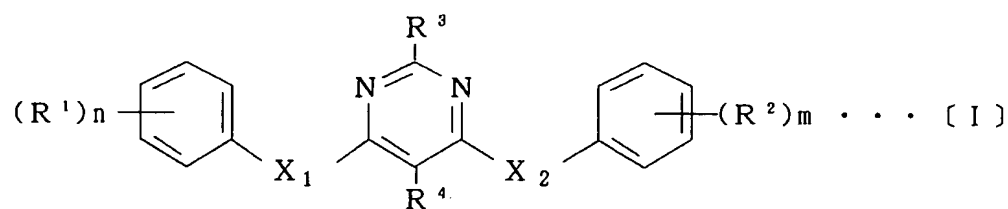
化合物A : WO94/02470号記載の化合物





## 請 求 の 範 囲

## 1. 一般式〔I〕



〔式中、 $R^1$  および  $R^2$  は、それぞれ独立して、ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、 $C_{1-6}$  アルキル基、 $C_{1-6}$  ハロアルキル基、 $C_{1-6}$  アルコキシ基、 $C_{1-6}$  ハロアルコキシ基、 $C_{1-6}$  アルキルチオ基、 $C_{1-6}$  アルキルスルフィニル基、 $C_{1-6}$  アルキルスルホニル基、 $C_{1-6}$  ハロアルキルチオ基、 $C_{1-6}$  ハロアルキルスルフィニル基、 $C_{1-6}$  ハロアルキルスルホニル基、（ハロゲン原子、 $C_{1-6}$  アルキル基もしくは  $C_{1-6}$  ハロアルキル基で置換されていてもよい）フェノキシ基または、（ハロゲン原子、 $C_{1-6}$  アルキル基もしくは  $C_{1-6}$  ハロアルキル基で置換されていてもよい）ピリジルオキシ基を表し、 $n$  および  $m$  は 1～5 の整数を表す。但し、 $n$  が 2 以上の整数を表すとき、 $R^1$  は同一でも相異なってもよく、 $m$  が 2 以上の整数を表すとき、 $R^2$  は同一でも相異なってもよい。

$R^3$  は、水素原子、ハロゲン原子、 $C_{1-4}$  アルキル基または  $C_{1-4}$  ハロアルキル基を表す。

$R^4$  は、式： $NR^5 R^6$  もしくは式： $N=CR^7 R^8$  で表される基、イソシアネート基またはイソチオシアネート基を表す。

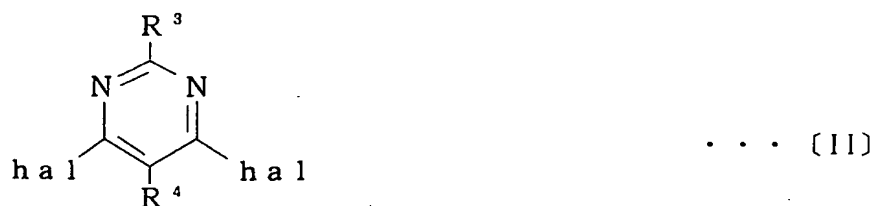
$R^5$  および  $R^6$  はそれぞれ独立して、水素原子、ホルミル基、ヒドロキシ基、（ハロゲン原子、シアノ基、 $C_{3-6}$  シクロアルキル基、 $C_{1-6}$  アルコキシ基、 $C_{1-6}$  ハロアルコキシ基、 $C_{1-6}$  アルキルカルボニル基、 $C_{1-6}$  アルコキシカルボニル基、 $C_{1-6}$  アルキルカルボニルオキシ基もしくはカルボキシ基で置換されていてもよい） $C_{1-6}$  アルキル基、 $C_{2-6}$  アルケニル基、 $C_{2-6}$  アルキニル基、 $C_{2-6}$  ハロアルケニル基、 $C_{2-6}$  ハロアルキニル基、 $C_{1-6}$  アルコキシ基、 $C_{2-6}$  アルケニルオキシ基、 $C_{2-6}$  アルキニルオキシ基、 $C_{1-6}$  ハロアルコキシ基、 $C_{1-6}$  アルキルカルボニルオキシ基、 $C_{1-6}$  ハロアルキルカルボニルオキシ基

、式： $\text{COR}^9$  ( $\text{R}^9$  は、 $\text{C}_{1-10}$ アルキル基、 $\text{C}_{1-6}$  ハロアルキル基、 $\text{C}_{1-6}$  ヒドロキシアルキル基、 $\text{C}_{1-6}$  アルコキシ基、 $\text{C}_{2-6}$  アルケニルオキシ基、 $\text{C}_{2-6}$  アルキニルオキシ基、 $\text{C}_{1-6}$  アルコキシ $\text{C}_{1-6}$  アルキル基、 $\text{C}_{1-6}$  アルコキシカルボニル基、 $\text{C}_{1-6}$  アルキルカルボニルオキシ $\text{C}_{1-6}$  アルキル基、( $\text{C}_{1-6}$  アルキル基もしくはハロゲン原子で置換されていてもよい) フェニル基、(ハロゲン原子、 $\text{C}_{1-6}$  アルキル基、 $\text{C}_{1-6}$  ハロアルキル基で置換されていてもよい) ピラゾリル基、 $\text{C}_{1-6}$  アルキルアミノ基、ジ $\text{C}_{1-6}$  アルキルアミノ基、フェニルアミノ基またはモルホリニル基を表す。) または 式： $\text{S}(\text{O})_k \text{R}^{10}$  ( $\text{R}^{10}$  は $\text{C}_{1-6}$  アルキル基、 $\text{C}_{1-6}$  ハロアルキル基、( $\text{C}_{1-6}$  アルキル基もしくはハロゲン原子で置換されていてもよい) フェニル基を表し、 $k$  は 0、1 または 2 を表す。) を表し、また、 $\text{N}$ 、 $\text{R}^5$  及び  $\text{R}^6$  が一緒になって環を形成してもよい。

$\text{R}^7$  および  $\text{R}^8$  は、それぞれ独立して、水素原子、 $\text{C}_{1-6}$  アルキル基、 $\text{C}_{1-6}$  アルコキシ基、 $\text{C}_{1-6}$  アルキルチオ基、アミノ基、 $\text{C}_{1-6}$  アルキルアミノ基、ジ $\text{C}_{1-6}$  アルキルアミノ基または( $\text{C}_{1-6}$  アルキル基もしくはハロゲン原子で置換されていてもよい) フェニル基を表す。

$\text{X}_1$  及び  $\text{X}_2$  はそれぞれ独立して、酸素原子または 式： $\text{N}(\text{R}^{11})$  を表し、 $\text{R}^{11}$  は、水素原子、 $\text{C}_{1-6}$  アルキル基、 $\text{C}_{2-6}$  アルケニル基、 $\text{C}_{2-6}$  アルキニル基、 $\text{C}_{1-6}$  アルコキシ $\text{C}_{1-6}$  アルキル基、ジ $\text{C}_{1-6}$  アルキルカルバモイル基、式： $\text{COR}^{12}$  ( $\text{R}^{12}$  は、水素原子、 $\text{C}_{1-6}$  アルキル基、 $\text{C}_{1-6}$  アルコキシ基、または、ハロゲン原子、 $\text{C}_{1-6}$  アルキル基、 $\text{C}_{1-6}$  アルコキシ基もしくはニトロ基で置換されていてもよい) フェニル基を表す。) または式： $\text{SO}_k \text{R}^{13}$  ( $\text{R}^{13}$  は $\text{C}_{1-6}$  アルキル基、 $\text{C}_{2-6}$  アルケニル基、 $\text{C}_{2-6}$  アルキニル基を表し、 $k$  は 0、1 または 2 を表す) を表す。) で表される化合物またはその塩。

## 2. 一般式〔II〕



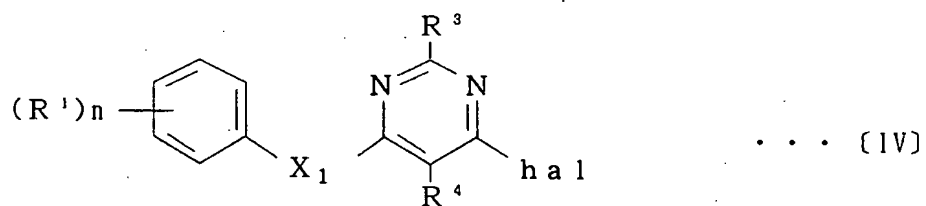
(式中、 $R^3$  及び  $R^4$  は第 1 項と同じ意味を表し、 $h a l$  は同一または相異なってハロゲン原子を表す。)

で表されるピリミジン類に、式〔III〕



(式中、 $R^1$ 、 $n$  及び  $X_1$  は第 1 項と同じ意味を表す。)

で表される化合物を、塩基の存在下に反応させて、式〔IV〕



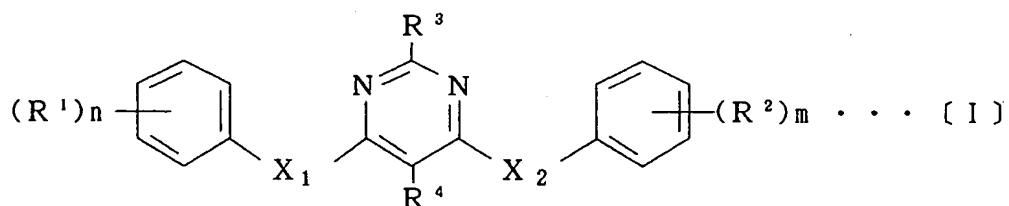
(式中、 $R^1$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $n$ 、 $X_1$  及び  $h a l$  は前記と同じ意味を表す。)

で表される化合物としたのち、式〔V〕



(式中、 $R^2$ 、 $m$  及び  $X_2$  は第 1 項と同じ意味を表す。)

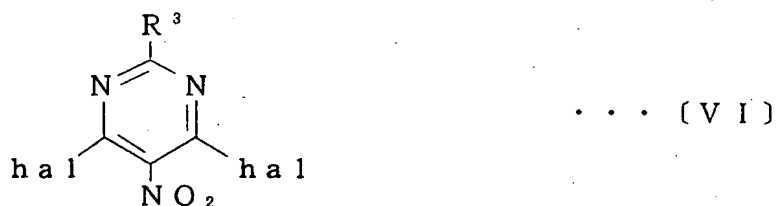
で表される化合物を反応させることを特徴とする、式〔I〕



(式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $n$ 、 $m$ 、 $X_1$  及び  $X_2$  は前記と同じ意味を表す。)

で表される化合物の製造法。

### 3. 式〔VI〕



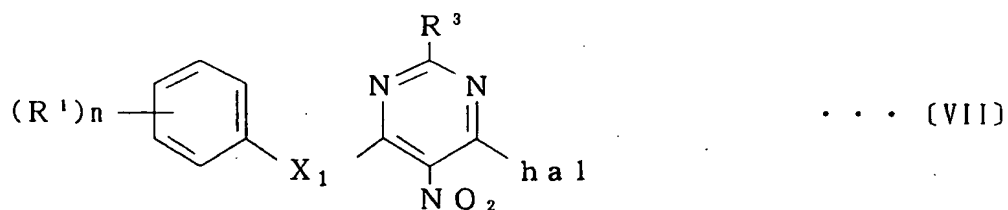
(式中、 $R^3$ 、 $hal$  は第2項と同じ意味を表す。)

で表されるピリミジン化合物に、式〔III〕

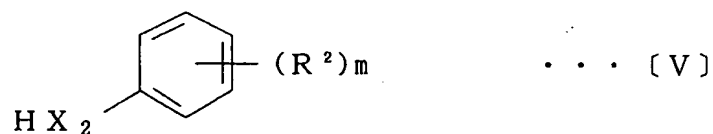


(式中、 $R^1$ 、 $n$  及び  $X_1$  は第2項と同じ意味を表す。)

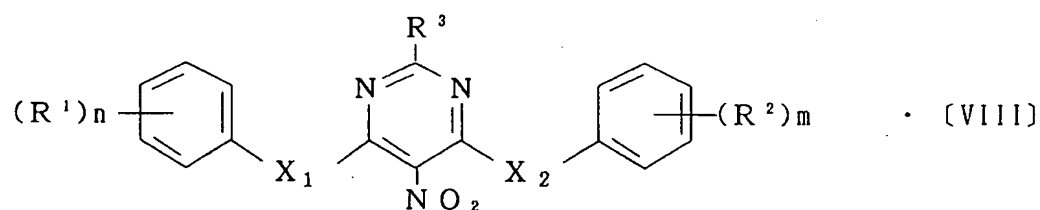
で表される化合物を、塩基の存在下に反応させて、式〔VII〕



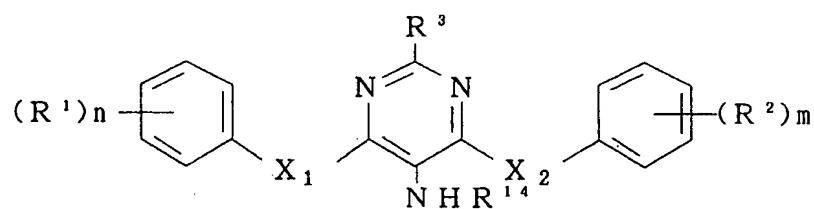
で表される化合物としたのち、式〔V〕



(式中、 $\text{R}^2$ 、 $m$ および $\text{X}_2$ は前記と同じ意味を表す。)で表される化合物と反応させて、式〔VIII〕

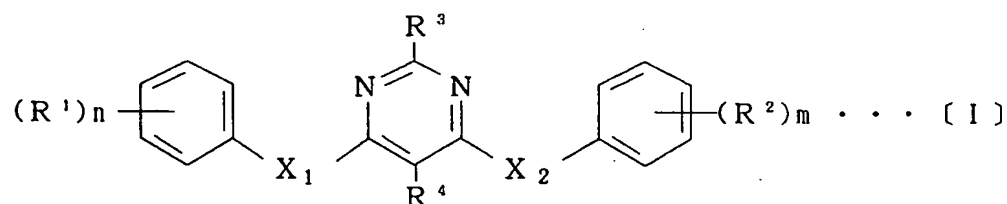


(式中、 $\text{R}^1$ 、 $\text{R}^2$ 、 $\text{R}^3$ 、 $n$ 、 $m$ 、 $\text{X}_1$ および $\text{X}_2$ は前記と同じ意味を表す。)で表される化合物を得、さらに、還元することを特徴とする式〔I〕



(式中、 $\text{R}^1$ 、 $\text{R}^2$ 、 $\text{R}^3$ 、 $n$ 、 $m$ 、 $\text{X}_1$ 、 $\text{X}_2$ は前記と同じ意味を表し、 $\text{R}^4$ は水素原子または水酸基を表す。)で表される化合物の製造法

#### 4. 式〔I〕



(式中、 $\text{R}^1$ 、 $\text{R}^2$ 、 $\text{R}^3$ 、 $\text{R}^4$ 、 $n$ 、 $m$ 、 $\text{X}_1$ 及び $\text{X}_2$ は第1項と同じ意味を表す。)

で表される化合物またはその塩の 1 種または 2 種以上を有効成分として含有することを特徴とする有害生物防除剤。

# INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP98/02329

## A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

Int.Cl<sup>6</sup> C07D239/46, C07D239/47, C07D239/48, C07D239/52, A01N43/54

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

## B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

Int.Cl<sup>6</sup> C07D239/46, C07D239/47, C07D239/48, C07D239/52, A01N43/54

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)  
CA (STN), REGISTRY (STN), WPIDS (STN)

## C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

| Category* | Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages   | Relevant to claim No. |
|-----------|--|-----------------------|
| A         | JP, 7-508999, A (Shell International Research Maatschappij B.V.),<br>October 5, 1995 (05. 10. 95),<br>All references & WO, 94/02470, A | 1-4                   |

☐ Further documents are listed in the continuation of Box C.

☐ See patent family annex.

\* Special categories of cited documents:

"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance

"E" earlier document but published on or after the international filing date

"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)

"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means

"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention

"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone

"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art

"&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search  
July 27, 1998 (27. 07. 98)

Date of mailing of the international search report  
August 4, 1998 (04. 08. 98)

Name and mailing address of the ISA/  
Japanese Patent Office

Authorized officer

Facsimile No.

Telephone No.

## 国際調査報告

国際出願番号 PCT/J P 98/02329

## A. 発明の属する分野の分類 (国際特許分類 (IPC))

Int cl<sup>o</sup> C07D239/46, C07D239/47, C07D239/48, C07D239/52, A01N43/54

## B. 調査を行った分野

調査を行った最小限資料 (国際特許分類 (IPC))

Int cl<sup>o</sup> C07D239/46, C07D239/47, C07D239/48, C07D239/52, A01N43/54

最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの

国際調査で使用了電子データベース (データベースの名称、調査に使用した用語)

CA (STN), REGISTRY (STN), WPIDS (STN)

## C. 関連すると認められる文献

| 引用文献の<br>カテゴリー* | 引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示   | 関連する<br>請求の範囲の番号 |
|-----------------|---|------------------|
| A               | J P, 7-508999, A (シエル・インターナショナル・リサーチ・マートシャツピー・ベー・ブイ) 5. 10月. 1995 (05. 10. 95) 文献全体 & WO, 94/02470, A | 1-4              |

☐ C欄の続きにも文献が列挙されている。☐ パテントファミリーに関する別紙を参照。

## \* 引用文献のカテゴリー

「A」 特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの

「E」 先行文献ではあるが、国際出願日以後に公表されたもの

「L」 優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献 (理由を付す)

「O」 口頭による開示、使用、展示等に言及する文献

「P」 国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願

の日の後に公表された文献

「T」 国際出願日又は優先日後に公表された文献であって出願と矛盾するものではなく、発明の原理又は理論の理解のために引用するもの

「X」 特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明の新規性又は進歩性がないと考えられるもの

「Y」 特に関連のある文献であって、当該文献と他の1以上の文献との、当業者にとって自明である組合せによって進歩性がないと考えられるもの

「&amp;」 同一パテントファミリー文献

国際調査を完了した日

27. 07. 98

国際調査報告の発送日

04.08.98

国際調査機関の名称及びあて先

日本国特許庁 (ISA/J P)

郵便番号 100-8915

東京都千代田区霞が関三丁目4番3号

特許庁審査官 (権限のある職員)

内藤 伸一



4C

8615

電話番号 03-3581-1101 内線 3452